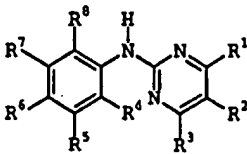



 INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

| | | |
|--|----|--|
| (51) Internationale Patentklassifikation ⁶ : A01N 43/54 | A1 | (11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 99/63821 (43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 16. Dezember 1999 (16.12.99) |
| (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP99/03751 (22) Internationales Anmeldedatum: 29. Mai 1999 (29.05.99) (30) Prioritätsdaten: 198 25 803.8 10. Juni 1998 (10.06.98) DE (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-67056 Ludwigshafen (DE). (72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): MÜLLER, Bernd [DE/DE]; Jean-Ganss-Strasse 21, D-67227 Frankenthal (DE). SAUTER, Hubert [DE/DE]; Neckarpromenade 20, D-68167 Mannheim (DE). BAYER, Herbert [DE/DE]; D 3.4, D-68159 Mannheim (DE). CULLMANN, Oliver [DE/DE]; Heinrich-Heine-Strasse 27, D-68199 Mannheim (DE). GEWEHR, Markus [DE/DE]; Goethestrasse 21, D-56288 Kastellaun (DE). GRAMMENOS, Wassilios [GR/DE]; Borsigstrasse 5, D-67063 Ludwigshafen (DE). GYPSE, Andreas [DE/DE]; B 4.4, D-68159 Mannheim (DE). PTOCK, Arne [DE/DE]; Eichenstrasse 23, D-67067 Ludwigshafen (DE). GÖTZ, Norbert [DE/DE]; Schöfferstrasse 25, D-67547 Worms (DE). GROTE, Thomas [DE/DE]; Breslauer Strasse 6, D-67105 | | Schifferstadt (DE). RACK, Michael [DE/DE]; Sandwingert 67, D-69123 Heidelberg (DE). AMMERMAN, Eberhard [DE/DE]; Von-Gagern-Strasse 2, D-64646 Heppenheim (DE). LORENZ, Gisela [DE/DE]; Erlenweg 13, D-67434 Neustadt (DE). STRATHMANN, Siegfried [DE/DE]; Donnersbergstrasse 9, D-67117 Limburgerhof (DE). SPEAKMAN, John-Bryan [GB/DE]; In den Hahndornen 7, D-67273 Bobenheim (DE). (74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGESELLSCHAFT; D-67056 Ludwigshafen (DE). (81) Bestimmungsstaaten: AL, AU, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, GE, HU, ID, IL, IN, JP, KR, KZ, LT, LV, MK, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TR, UA, US, ZA, eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE). Veröffentlicht Mit internationalem Recherchenbericht. Vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche zugelassenen Frist; Veröffentlichung wird wiederholt falls Änderungen eintreffen. |
| (54) Title: USE OF 2-(N-PHENYLAMINO)PYRIMIDINES AS FUNGICIDES, AND NOVEL 2-(N-PHENYLAMINO)PYRIMIDINES | | |
| (54) Bezeichnung: VERWENDUNG VON 2-(N-PHENYLAMINO)PYRIMIDINEN ALS FUNGIZIDE SOWIE NEUE 2-(N-PHENYLAMINO)PYRIMIDINE | | |
| <div style="text-align: center;">  </div> <div style="text-align: right;">(I)</div> | | |
| (57) Abstract The invention relates to the use of 2-(N-phenylamino)pyrimidines of formula (I) wherein the substituents have the following meanings: R ¹ , R ³ represent, independently of each other, cyano, C ₁ -C ₈ -alkyl, C ₂ -C ₆ -alkenyl, C ₂ -C ₆ -alkinyl, in which case the alkyl, alkenyl and alkynyl radicals can be substituted by cyano, halogen, C ₁ -C ₄ -alkoxy or C ₁ -C ₄ -alkoxycarbonyl; C ₃ -C ₈ -cycloalkyl or a group C(=NOR ^x)R ^y ; and R ² represents halogen, C ₁ -C ₈ -alkyl, C ₂ -C ₆ -alkenyl, C ₂ -C ₆ -alkinyl and the alkyl, alkenyl and alkynyl radicals can be substituted by cyano, halogen, C ₁ -C ₄ -alkoxy or C ₁ -C ₄ -alkoxycarbonyl; or R ¹ and R ² , together with the two carbon atoms with which they are bonded, form an anellated, partially unsaturated 4- to 8-membered ring which can be identically or differently substituted up to three times by C ₁ -C ₄ -alkyl, halogen or C ₁ -C ₄ -alkoxycarbonyl, which can contain a carbonyl group and/or a double bond in addition to the multiple bond of the pyrimidine ring and/or which can be interrupted by O, S or N-(C ₁ -C ₄ -alkyl), the substituents R ⁴ to R ⁸ , R ^x , R ^y , R ^a and R ^b having the meanings given in the description, as fungicides. | | |
| ATTORNEY DOCKET NUMBER: 10624-049-99 SERIAL NUMBER: 10/004,642 REFERENCE: BD | | |

(57) Zusammenfassung

Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung von 2-(N-Phenylamino)pyrimidinen der Formel (I), in der die Substituenten die folgende Bedeutung haben: R¹, R³ unabhängig voneinander Cyano, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, wobei die Reste Alkyl, Alkenyl und Alkynyl durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl substituiert sein können, C₃-C₈-Cycloalkyl oder eine Gruppe C(=NOR^x)R^y; R² Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, wobei die Reste Alkyl, Alkenyl und Alkynyl durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl substituiert sein können, oder R¹ und R² gemeinsam mit den beiden Kohlenstoffatomen, an welche sie gebunden sind einen anellierten, teilweise ungesättigten 4- bis 8-gliedrigen Ring, der bis zu dreifach gleich oder verschieden durch C₁-C₄-Alkyl, Halogen oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl substituiert sein kann, eine Carbonylgruppe und/oder zusätzlich zu der Mehrfachbindung des Pyrimidinrings eine Doppelbindung enthalten kann und/oder durch O, S oder N-(C₁-C₄-Alkyl) unterbrochen sein kann; die Substituenten R⁴ bis R⁸, R^x, R^y, R^a und R^b die in der Beschreibung angegebene Bedeutung haben; als Fungizide.

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

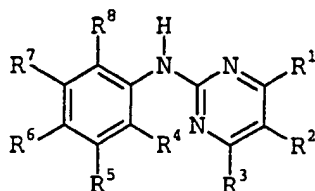
| | | | | | | | |
|----|------------------------------|----|-----------------------------------|----|---|----|--------------------------------|
| AL | Albanien | ES | Spanien | LS | Lesotho | SI | Slowenien |
| AM | Armenien | FI | Finnland | LT | Litauen | SK | Slowakei |
| AT | Österreich | FR | Frankreich | LU | Luxemburg | SN | Senegal |
| AU | Australien | GA | Gabun | LV | Lettland | SZ | Swasiland |
| AZ | Aserbaidshjan | GB | Vereinigtes Königreich | MC | Monaco | TD | Tschad |
| BA | Bosnien-Herzegowina | GE | Georgien | MD | Republik Moldau | TG | Togo |
| BB | Barbados | GH | Ghana | MG | Madagaskar | TJ | Tadschikistan |
| BE | Belgien | GN | Guinea | MK | Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien | TM | Turkmenistan |
| BF | Burkina Faso | GR | Griechenland | ML | Mali | TR | Türkei |
| BG | Bulgarien | HU | Ungarn | MN | Mongolei | TT | Trinidad und Tobago |
| BJ | Benin | IE | Irland | MR | Mauretanien | UA | Ukraine |
| BR | Brasilien | IL | Israel | MW | Malawi | UG | Uganda |
| BY | Belarus | IS | Island | MX | Mexiko | US | Vereinigte Staaten von Amerika |
| CA | Kanada | IT | Italien | NE | Niger | UZ | Usbekistan |
| CF | Zentralafrikanische Republik | JP | Japan | NL | Niederlande | VN | Vietnam |
| CG | Kongo | KE | Kenia | NO | Norwegen | YU | Jugoslawien |
| CH | Schweiz | KG | Kirgisistan | NZ | Neuseeland | ZW | Zimbabwe |
| CI | Côte d'Ivoire | KP | Demokratische Volksrepublik Korea | PL | Polen | | |
| CM | Kamerun | KR | Republik Korea | PT | Portugal | | |
| CN | China | KZ | Kasachstan | RO | Rumänien | | |
| CU | Kuba | LC | St. Lucia | RU | Russische Föderation | | |
| CZ | Tschechische Republik | LI | Liechtenstein | SD | Sudan | | |
| DE | Deutschland | LK | Sri Lanka | SE | Schweden | | |
| DK | Dänemark | LR | Liberia | SG | Singapur | | |
| EE | Estland | | | | | | |

Verwendung von 2-(N-Phenylamino)pyrimidinen als Fungizide sowie neue 2-(N-Phenylamino)pyrimidine

5 Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung von 2-(N-Phenylamino)pyrimidinen der Formel I,

10



I

15

in der die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

- R^1, R^3 unabhängig voneinander Cyano, C_1 - C_8 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkynyl, wobei die Reste Alkyl, Alkenyl und Alkynyl durch Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy oder C_1 - C_4 -Alkoxycarbonyl substituiert sein können, C_3 - C_8 -Cycloalkyl oder eine Gruppe $C(=NOR^x)R^y$
- R^x Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkynyl, wobei die Reste Alkyl, Alkenyl und Alkynyl durch Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy oder Phenyl substituiert sein können;
- R^y Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkynyl, wobei die Reste Alkyl, Alkenyl und Alkynyl durch Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiert sein können.
- R^2 Halogen, C_1 - C_8 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkynyl, wobei die Reste Alkyl, Alkenyl und Alkynyl durch Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy oder C_1 - C_4 -Alkoxycarbonyl substituiert sein können, oder
- R^1 u. R^2 gemeinsam mit den beiden Kohlenstoffatomen an welche sie gebunden sind einen anellierten, teilweise ungesättigten 4- bis 8-gliedrigen Ring, der bis zu dreifach gleich oder verschieden durch C_1 - C_4 -Alkyl, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkoxycarbonyl substituiert sein kann, eine Carbonylgruppe und/oder zusätzlich zu der Mehrfachbindung des Pyrimidinrings eine Doppelbindung enthalten kann und/oder durch O, S oder N-(C_1 - C_4 -Alkyl) unterbrochen sein kann;

R⁴ bis R⁸ unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, Halogen, R^a, R^aO, R^aS(O)_m, R^aO-(C=O), R^a(C=O), R^aR^bN-(C=O), R^aHN-(C=O), H₂N-(C=O), R^a-(C=O)-NH, R^a-(C=O)-NR^b oder R^aO-N=C(R^b);

5

R^a, R^b C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl oder C₃-C₆-Alkynyl, welche jeweils durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl oder Phenyl substituiert sein können oder Phenyl, welches ein bis drei Substituenten ausgewählt aus der Gruppe: Halogen und C₁-C₄-Alkyl tragen kann;

10

m 0, 1 oder 2;

als Fungizide.

15

Aus der EP-A 224 339, EP-A 270 111, EP-A 310 550, EP-A 457 726, DD 151404 und JP 03/271278 sind fungizide 2-(N-Phenylamino)pyrimidine bekannt, die in 5-Stellung am Pyrimidinring ein Wasserstoffatom tragen.

20

In 5-Stellung substituierte 2-(N-Phenylamino)pyrimidine sind bisher als Zwischenprodukte für herbizide Wirkstoffe (EP-A 337 944) und als Pharmazeutika (WO-A 97/19065) beschrieben.

25 Schließlich sind aus der EP-A 172 786 fungizide 2-(N-Phenylamino)pyrimidine bekannt, die in 5-Stellung substituiert sein können und an der Aminofunktion einen speziellen 2-Nitrophenylrest tragen.

30 Die in der EP-A 172 786 genannten Verbindungen können jedoch die in der Praxis an Wirkstoffe gestellten Forderungen nicht immer voll befriedigen.

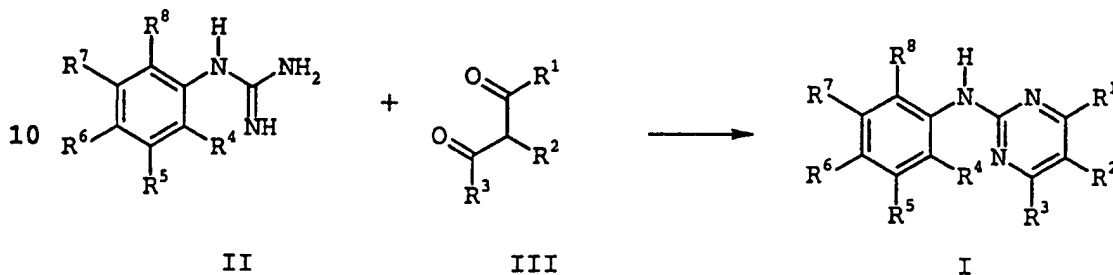
Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es, fungizide Wirkstoffe
35 mit verbesserten Eigenschaften zu finden.

Demgemäß wurde gefunden, daß sich die eingangs erwähnten Verbindungen, die z. Teil bereits in den Schriften EP-A 337 944 und WO-A 97/19065 erwähnt wurden, hervorragend zur Bekämpfung von
40 Schadpilzen eignen. Darüberhinaus wurden neue 2-(N-Phenylamino)pyrimidine mit verbesserter fungizider Wirkung gefunden.

Gemeinsam ist allen erfindungsgemäßen Aminopyrimidinen, den neuen wie den aus EP-A 337 944 und WO-A 97/19065 bekannten, daß sie in
45 4-, 5- und 6-Stellung jeweils einen hydrophoben Substituenten tragen.

Die neuen 2-(N-Phenylamino)pyrimidinen können analog zu literaturbekannten Verfahren hergestellt werden. Insbesondere bieten sich die in Schema 1 und 2 aufgeführten Verfahrensrouten an.

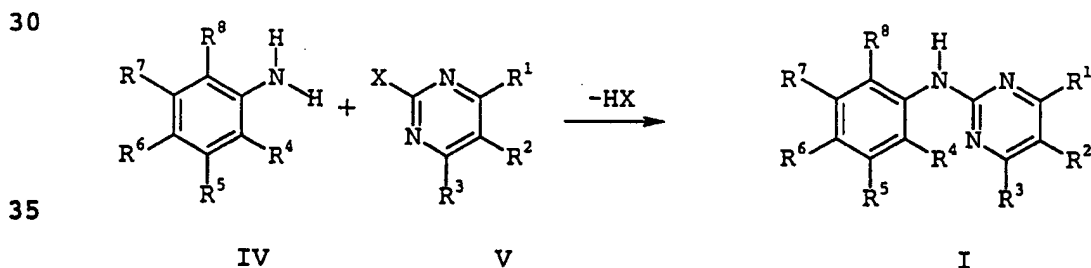
5 Schema 1



15 Die Kondensationsreaktion der Guanidine II mit 1,3-Dicarbonylverbindungen der Formel III zu den 2-(N-Phenylamino)pyrimidinen I kann wie in der EP-A 337 944 und der dort zitierten Literatur beschrieben durchgeführt werden.

20 Hinsichtlich der Synthese der Guanidine II sei auf die Literaturstellen: Houben Weyl, Methoden d. Org. Chemie, Stuttgart, Bd. VIII S. 98, 180 bis 189 verwiesen. Die 1,3-Diketone III lassen sich beispielsweise entweder durch a) Claisen Kondensation oder
25 durch b) Alkylierung bzw. Halogenierung eines in 2-Stellung unsubstituierten 1,3-Diketons herstellen (Organikum, 1993 Barth Verlagsgesellschaft Leipzig, a) S.487 b) S. 536).

Schema 2



Die Herstellung der 2-(N-Phenylamino)pyrimidinen I ausgehend von
40 Anilinderivaten der Formel IV und Pyrimidinderivaten der Formel V, wobei X für eine nukleophil austauschbare Gruppe wie Halogen oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl steht, ist in der EP-A 337 944 beschrieben.

45

4

Die erfindungsgemäßen Verbindungen I, in denen $R^3 C(=NOR^x)R^y$ bedeutet, werden bevorzugt aus den Aldehyden VI hergestellt (s. Schema 3), wobei die Aldehyde VI ihrerseits analog EP-A 457 726 synthetisiert werden können.

5

Verbindungen Ia, in denen $R^3 CH(=NOR^x)$ bedeutet, werden durch Umsetzung der Aldehyde VI mit den Alkoxyaminen VII unter an sich bekannten Bedingungen erhalten (Schema 3).

10 Außerdem können die Aldehyde VI unter an sich bekannten Bedingungen mit metallorganischen Reagenzien, wie z. B. Grignard-Verbindungen VIII (R^y-Mg-X ; $X = Cl, Br, I$) zu den sekundären Alkoholen IX umgesetzt werden.

15 Die Oxidation dieser Alkohole IX, vorzugsweise nach Swern mit Oxalylchlorid/DMSO, liefert die Ketone X, die ihrerseits mit Alkoxyaminen VII zu den erfindungsgemäßen Verbindungen Ib umgesetzt werden können.

20 Schema 3

25

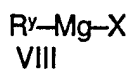
30

35

40

45

10



15



25

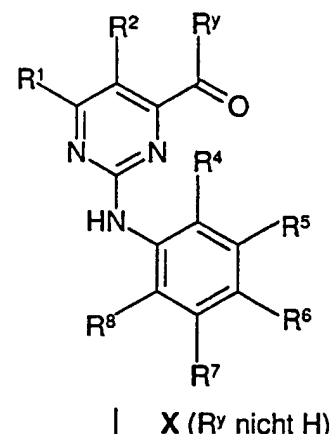
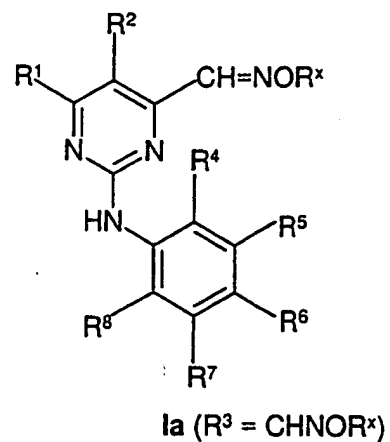
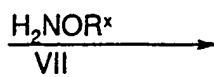


30

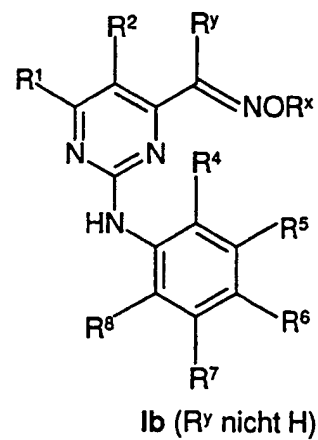
35

40

45



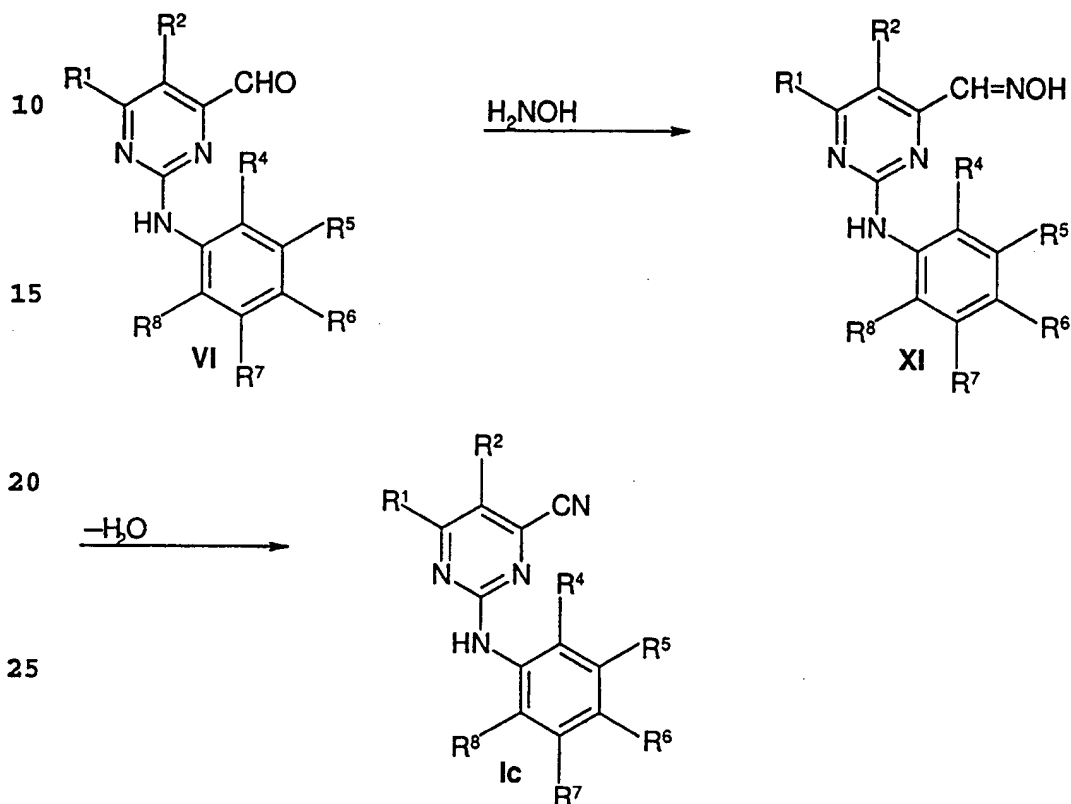
X (Ry nicht H)



Die Wirkstoffe Ic, bei denen R³ Cyano bedeutet (Schema 4), können bevorzugt durch Umsetzung der Aldehyd VI mit Hydroxylamin und Dehydratisierung der so gebildeten Oxime XI hergestellt werden (analog EP-A 457 726).

5

Schema 4



Bei der eingangs angegebenen Definition der Verbindungen I wurden für die Reste R¹ bis R⁸, R^x und R^y sowie R^a und R^b Sammelbegriffe verwendet, die für individuelle Aufzählungen der einzelnen Gruppenmitglieder stehen. Die Reste Alkyl, Alkoxy, Alkoxy-carbonyl, Alkenyl und Alkynyl können geradkettig oder verzweigt sein.

35

Beispielsweise bedeuten:

- Halogen: Fluor, Chlor, Brom oder Jod;
- 40 - C₁-C₄-Alkyl: Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl oder 1,1-Dimethylethyl;
- C₁-C₈-Alkyl: C₁-C₄-Alkyl, wie voranstehend genannt, sowie
- 45 Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl,

1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Tri-methylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl, 1-Ethyl-3-methylpropyl, Heptyl, Octyl oder 2-Ethylhexyl;

5

- C₁-C₂-Halogenalkyl: einen C₁-C₂-Alkylrest wie vorstehend ge-
nannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom
und/oder Jod substituiert ist, also z.B. Chlormethyl,
Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl,
10 Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlor-
difluormethyl, 2-Fluorethyl, 2-Chlorethyl, 2-Bromethyl, 2-Jo-
dethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl,
2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl,
2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl oder Penta-
15 fluorethyl;

- C₁-C₄-Alkoxy sowie die Alkoxyteile von C₁-C₄-Alkoxycarbonyl:
Methoxy, Ethoxy, Propoxy, 1-Methylethoxy, Butoxy, 1-Methyl-
propoxy, 2-methylpropoxy oder 1,1-Dimethylethoxy;

20

- C₁-C₂-Halogenalkoxy: einen C₁-C₂-Alkoxyrest wie voranstehend
genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor,
Brom und/oder Jod substituiert ist, also z.B. Fluormethoxy,
Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Bromdi-
25 fluormethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Chlorethoxy, 2-Brommethoxy,
2-Jodethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy,
2-Chlor-2-fluorethoxy, 2-Chlor-2,2-difluorethoxy,
2,2-Dichlor-2-fluorethoxy, 2,2,2-Trichlorethoxy, Pentafluor-
ethoxy;

30

- C₂-C₆-Alkenyl: Ethylen, Prop-1-en-1-yl, Prop-2-en-1-yl,
1-Methylethenyl, Buten-1-yl, Buten-2-yl, Buten-3-yl,
1-Methyl-prop-1-en-1-yl, 2-Methyl-prop-1-en-1-yl, 1-Methyl-
prop-2-en-1-yl und 2-Methyl-prop-2-en-1-yl, Penten-1-yl,
35 Penten-2-yl, Penten-3-yl, Penten-4-yl, 1-Methyl-
but-1-en-1-yl, 2-Methyl-but-1-en-1-yl, 3-Methyl-
but-1-en-1-yl, 1-Methyl-but-2-en-1-yl, 2-Methyl-
but-2-en-1-yl, 3-Methyl-but-2-en-1-yl, 1-Methyl-
but-3-en-1-yl, 2-Methyl-but-3-en-1-yl, 3-Methyl-
40 but-3-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-prop-2-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-
prop-1-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-
prop-1-en-2-yl, 1-Ethyl-prop-2-en-1-yl, Hex-1-en-1-yl,
Hex-2-en-1-yl, Hex-3-en-1-yl, Hex-4-en-1-yl, Hex-5-en-1-yl,
1-Methyl-pent-1-en-1-yl, 2-Methyl-pent-1-en-1-yl,
45 3-Methyl-pent-1-en-1-yl, 4-Methyl-pent-1-en-1-yl,
1-Methyl-pent-2-en-1-yl, 2-Methyl-pent-2-en-1-yl,
3-Methyl-pent-2-en-1-yl, 4-Methyl-pent-2-en-1-yl,

- 1-Methyl-pent-3-en-1-yl, 2-Methyl-pent-3-en-1-yl,
 3-Methyl-pent-3-en-1-yl, 4-Methyl-pent-3-en-1-yl,
 1-Methyl-pent-4-en-1-yl, 2-Methyl-pent-4-en-1-yl,
 3-Methyl-pent-4-en-1-yl, 4-Methyl-pent-4-en-1-yl,
 5 1,1-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-but-3-en-1-yl,
 1,2-Dimethyl-but-1-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-but-2-en-1-yl,
 1,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl,
 1,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl,
 2,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl,
 10 2,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl,
 3,3-Dimethyl-but-1-en-1-yl, 3,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl,
 1-Ethyl-but-1-en-1-yl, 1-Ethyl-but-2-en-1-yl, 1-Ethyl-
 but-3-en-1-yl, 2-Ethyl-but-1-en-1-yl, 2-Ethyl-but-2-en-1-yl,
 2-Ethyl-but-3-en-1-yl, 1,1,2-Trimethyl-prop-2-en-1-yl,
 15 1-Ethyl-1-methyl-prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-2-methyl-
 prop-1-en-1-yl oder 1-Ethyl-2-methyl-prop-2-en-1-yl;
- C₂-C₆-Alkynyl: Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl,
 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl,
 20 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl,
 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl,
 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl,
 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-
 pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Meth-
 25 yl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl,
 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl,
 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-
 3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl,
 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl oder
 30 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;
- C₃-C₈-Cycloalkyl: Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclo-
 hexyl, Cycloheptyl oder Cyclooctyl;
- 35 Hinsichtlich ihrer Verwendung als Fungizide sind 2-(N-Phenyla-
 mino)pyrimidine I mit folgenden Substituenten bevorzugt, wobei
 die Bevorzugung jeweils für sich allein oder in Kombination zu
 sehen ist:
- 40 R¹, R³ Cyano, C₁-C₈-Alkyl, Propinyl, C₁-C₂-Haloalkyl, Cyclopropyl
 oder eine Gruppe C(=NOR^x)R^y;
- R² Halogen oder C₁-C₈-Alkyl;
- 45 R⁴ bis R⁸ unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, Halogen,
 C₁-C₂-Haloalkyl, C₁-C₂-Haloalkoxy, R^a oder R^aO-N=C(R^b);

R^a, R^b C₁-C₄-Alkyl.

Insbesondere bevorzugt sind 2-(N-Phenylamino)pyrimidine I mit folgenden Substituenten, wobei die Bevorzugung jeweils für sich allein oder in Kombination zu sehen ist:

R¹, R³ Cyano, Methyl, Ethyl, Cyclopropyl, CH(=NOCH₃),
CH(=NOC₂H₅), C(=NOCH₃)CH₃ oder C(=NOC₂H₅)CH₃;

10 R² Fluor, Chlor, Methyl oder Ethyl;

R⁴ bis R⁸ unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl.

15 Am meisten bevorzugt sind 2-(N-Phenylamino)pyrimidine I mit folgenden Substituenten, wobei die Bevorzugung jeweils für sich allein oder in Kombination zu sehen ist.

R¹ Methyl oder Cyclopropyl;

20

R² Methyl oder Fluor;

R³ CH(=NOCH₃), CH(=NOC₂H₅), C(=NOCH₃)CH₃, C(=NOC₂H₅)CH₃,
Cyano oder Methyl und

25

R⁴ bis R⁸ Wasserstoff.

Folgende Wirkstoffgruppen sind aufgrund ihrer ausgeprägten pflanzenfungiziden Aktivität bevorzugt.

30

Gruppe Ia: 2-(N-Phenylamino)pyrimidine der Formel I, in der

R¹, R³ Cyano, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl oder
C₃-C₈-Cycloalkyl;

35

R² Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl oder
C₁-C₂-Haloalkyl;

R⁴, R⁶, R⁸ unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, Halogen, R^a,
40 R^aO, R^aS(O)_m, R^aO-(C=O), R^a(C=O), R^aR^bN-(C=O),
R^aHN-(C=O), H₂N-(C=O), R^a-(C=O)-NH, R^a-(C=O)-NR^b oder
R^aO-N=C(R^b);

R⁵, R⁷ unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, R^a, R^aO,
45 R^aS(O)_m, R^aO-(C=O), R^a(C=O), R^aR^bN-(C=O), R^aHN-(C=O),
H₂N-(C=O), R^a-(C=O)-NH, R^a-(C=O)-NR^b oder R^aO-N=C(R^b);

R^a, R^b C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl oder C₃-C₆-Alkynyl, welche jeweils durch Cyano, Halogen, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl oder Phenyl substituiert sein können oder Phenyl, welches ein bis drei Substituenten ausgewählt aus der Gruppe: Halogen und C₁-C₄-Alkyl tragen kann, und

m 0,1 oder 2 bedeuten.

Bevorzugt sind 2-(N-Phenylamino)pyrimidine der Gruppe Ia, in der

R¹ Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Propinyl oder Cyclopropyl;

R² Methyl, Ethyl, Fluor oder Chlor;

R³ Methyl;

R⁴, R⁶, R⁸ unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, Halogen, C₁-C₂-Haloalkoxy, R^a oder R^aO-N=C(R^b) und vorzugsweise Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl;

R⁵, R⁷ unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, C₁-C₂-Haloalkoxy, R^a oder R^aO-N=C(R^b) und vorzugsweise Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl und

R^a, R^b C₁-C₄-Alkyl bedeuten.

Gruppe Ib: 2-(N-Phenylamino)pyrimidine der Formel I, in der

R¹ Cyano oder C₂-C₆-Alkynyl und

die Reste R² bis R⁸ die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben.

Bevorzugt sind 2-(N-Phenylamino)pyrimidine der Gruppe Ib, in der

R¹ Cyano oder Propinyl;

R² Halogen oder C₁-C₈-Alkyl und vorzugsweise Fluor, Chlor, Methyl oder Ethyl;

R³ Cyano, C₁-C₈-Alkyl, Propinyl, C₁-C₂-Haloalkyl oder Cyclopropyl und vorzugsweise Methyl, Ethyl, n-Propyl, Propinyl oder Cyclopropyl;

11

R⁴ bis R⁸ unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, Halogen, C₁-C₂-Haloalkyl, C₁-C₂-Haloalkoxy, R^a oder R^aO-N=C(R^b) und vorzugsweise Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl und

5 R^a, R^b C₁-C₄-Alkyl bedeuten.

Gruppe Ic: 2-(N-Phenylamino)pyrimidine der Formel I, in der

R⁴ bis R⁸ Wasserstoff und

10

die Reste R¹ bis R³ die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben.

Bevorzugt sind 2-(N-Phenylamino)pyrimidine der Gruppe Ic, in der

15

R¹, R³ Cyano, C₁-C₈-Alkyl, Propinyl, C₁-C₂-Haloalkyl oder Cyclopropyl und vorzugsweise Methyl, Ethyl, n-Propyl, Propinyl oder Cyclopropyl;

20

R² Halogen oder C₁-C₈-Alkyl und vorzugsweise Fluor, Chlor, Methyl oder Ethyl und

R⁴ bis R⁸ Wasserstoff bedeuten.

25 Gruppe Id: 2-(N-Phenylamino)pyrimidine der Formel I, in der

R² Halogen;

30

R⁴, R⁸ unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, Halogen, C₁-C₂-Haloalkoxy, R^a, R^aO, R^aS(O)_m, R^aO-(C=O), R^a(C=O), R^aR^bN-(C=O), R^aHN-(C=O), H₂N-(C=O), R^a-(C=O)-NH, R^a-(C=O)-NR^b oder R^aO-N=C(R^b);

35

R⁵ bis R⁷ unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, Halogen, C₁-C₂-Haloalkyl, C₁-C₂-Haloalkoxy, R^a, R^aO, R^aS(O)_m, R^aO-(C=O), R^a(C=O), R^aR^bN-(C=O), R^aHN-(C=O), H₂N-(C=O), R^a-(C=O)-NH, R^a-(C=O)-NR^b oder R^aO-N=C(R^b);

40

R^a, R^b C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl oder C₃-C₆-Alkinyl, welche jeweils durch Cyano, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl oder Phenyl substituiert sein können oder Phenyl, welches ein bis drei Substituenten ausgewählt aus der Gruppe: Halogen und C₁-C₄-Alkyl tragen kann, und

45 die Reste R¹ und R³ die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben.

12

Bevorzugt sind 2-(N-Phenylamino)pyrimidine der Gruppe Id, in der

5 R^1, R^3 Cyano, C_1-C_8 -Alkyl, Propinyl, C_1-C_2 -Haloalkyl oder Cyclopropyl und vorzugsweise Methyl, Ethyl, n-Propyl, Propinyl oder Cyclopropyl;

R^2 Fluor oder Chlor;

10 R^4, R^8 unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, Halogen, C_1-C_2 -Haloalkoxy, R^a oder $R^aO-N=C(R^b)$ und vorzugsweise Wasserstoff, Halogen oder C_1-C_4 -Alkyl;

15 R^5 bis R^7 unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, Halogen, C_1-C_2 -Haloalkyl, C_1-C_2 -Haloalkoxy, R^a oder $R^aO-N=C(R^b)$ und vorzugsweise Wasserstoff, Halogen oder C_1-C_4 -Alkyl und

R^a, R^b C_1-C_4 -Alkyl bedeuten.

Gruppe Ie: 2-(N-Phenylamino)pyrimidine der Formel I, in der

20 R^1, R^3 C_1-C_8 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl oder C_2-C_6 -Alkinyl, wobei die Reste Alkenyl und Alkinyl durch Cyano, Halogen, C_1-C_4 -Alkoxy oder C_1-C_4 -Alkoxycarbonyl substituiert sein können;

25 R^2 C_1-C_8 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl oder C_2-C_6 -Alkinyl;

30 R^5, R^7 unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, R^a , R^aO , $R^aS(O)_m$, $R^aO-(C=O)$, $R^a(C=O)$, $R^aR^bN-(C=O)$, $R^aHN-(C=O)$, $H_2N-(C=O)$, $R^a-(C=O)-NH$, $R^a-(C=O)-NR^b$ oder $R^aO-N=C(R^b)$;

die Reste R^4 , R^6 und R^8 die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben.

35 Bevorzugt sind 2-(N-Phenylamino)pyrimidine der Gruppe Ie, in der

R^1, R^3 Methyl, Ethyl, n-Propyl oder Propinyl;

R^2 Methyl, Ethyl oder n-Propyl;

40 R^4, R^6, R^8 unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, Halogen, C_1-C_2 -Haloalkyl, C_1-C_2 -Haloalkoxy, R^a oder $R^aO-N=C(R^b)$ und vorzugsweise Wasserstoff, Halogen oder C_1-C_4 -Alkyl;

13

R⁵, R⁷ unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, C₁-C₂-Haloalkyl, C₁-C₂-Haloalkoxy, R^a oder R^aO-N=C(R^b) und vorzugsweise Wasserstoff, Cyano, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₂-Haloalkyl und

5

R^a, R^b C₁-C₄-Alkyl bedeuten.

Gruppe If: 2-(N-Phenylamino)pyrimidine der Formel I, in der

10 R⁴, R⁸ Wasserstoff;

R⁵, R⁷ unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, C₁-C₂-Haloalkoxy, R^a, R^aO, R^aS(O)_m, R^aO-(C=O), R^a(C=O), R^aR^bN-(C=O), R^aHN-(C=O), H₂N-(C=O), R^a-(C=O)-NH, R^a-(C=O)-NR^b oder R^aO-N=C(R^b);

15

R⁶ unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, Halogen, C₁-C₂-Haloalkyl, C₁-C₂-Haloalkoxy, R^a, R^aO, R^aS(O)_m, R^aO-(C=O), R^a(C=O), R^aR^bN-(C=O), R^aHN-(C=O), H₂N-(C=O), R^a-(C=O)-NH, R^a-(C=O)-NR^b oder R^aO-N=C(R^b);

20

R^a, R^b C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Alkenyl oder C₃-C₆-Alkinyl, welche jeweils durch Cyano, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxycarbonyl oder Phenyl substituiert sein können oder Phenyl, welches ein bis drei Substituenten ausgewählt aus der Gruppe: Halogen und C₁-C₄-Alkyl tragen kann, und

25

die Reste R¹ bis R³ die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben.

30

Bevorzugt sind 2-(N-Phenylamino)pyrimidine der Gruppe If, in der

R¹, R³ Cyano, C₁-C₈-Alkyl, Propinyl, C₁-C₂-Haloalkyl oder Cyclopropyl und vorzugsweise Methyl, Ethyl, n-Propyl, Propinyl oder Cyclopropyl;

35

R² Halogen oder C₁-C₈-Alkyl und vorzugsweise Fluor, Chlor, Methyl oder Ethyl;

40 R⁴, R⁸ Wasserstoff;

R⁵, R⁷ unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, C₁-C₂-Haloalkoxy, R^a oder R^aO-N=C(R^b) und vorzugsweise Wasserstoff, Cyano, R^a oder R^aO-N=C(R^b);

45

R⁶ unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, Halogen, C₁-C₂-Haloalkyl, C₁-C₂-Haloalkoxy, R^a oder R^aO-N=C(R^b) und vorzugsweise Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl und

5 R^a, R^b C₁-C₄-Alkyl bedeuten.

Gruppe Ig: 2-(N-Phenylamino)pyrimidine der Formel I, in der

R¹ Cyclopropyl;

10

R³ Cyano, C₁-C₈-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkynyl, wobei die Reste Alkyl, Alkenyl und Alkynyl durch Cyano, C₁-C₄-Alkoxy oder C₁-C₄-Alkoxycarbonyl substituiert sein können, oder C₃-C₈-Cycloalkyl;

15

die Reste R² und R⁴ bis R⁸ die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben.

Bevorzugt sind 2-(N-Phenylamino)pyrimidine der Gruppe Ig, in der

20

R¹ Cyclopropyl;

R² Halogen oder C₁-C₈-Alkyl und vorzugsweise Fluor, Chlor, Methyl oder Ethyl;

25

R³ Cyano, C₁-C₈-Alkyl, Propinyl oder Cyclopropyl und vorzugsweise Methyl, Ethyl, n-Propyl, Propinyl oder Cyclopropyl;

R⁴ bis R⁸ unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, Halogen,

30

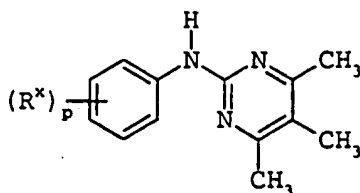
C₁-C₂-Haloalkyl, C₁-C₂-Haloalkoxy, R^a oder R^aO-N=C(R^b) und vorzugsweise Wasserstoff, Halogen oder C₁-C₄-Alkyl und

R^a, R^b C₁-C₄-Alkyl bedeuten.

35 Beispiele für insbesondere bevorzugte 2-(N-Phenylamino)pyrimidine sind in den folgenden Tabellen zusammengestellt.

Tabelle 1

40



I.1

45 2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.1-001 bis I.1-379 der allgemeinen Formel I.1.

| | Nummer | (R*) _p |
|----|--------|---------------------------------------|
| | 1 | H |
| | 2 | 2-F |
| 5 | 3 | 4-F |
| | 4 | 2,4-F ₂ |
| | 5 | 2,4,6-F ₃ |
| | 6 | 2,6-F ₂ |
| 10 | 7 | 2-Cl |
| | 8 | 4-Cl |
| | 9 | 2,4-Cl ₂ |
| | 10 | 2,6-Cl ₂ |
| | 11 | 2,4,6-Cl ₃ |
| 15 | 12 | 2-Br |
| | 13 | 4-Br |
| | 14 | 2,4-Br ₂ |
| | 15 | 2,6-Br ₂ |
| 20 | 16 | 2,4,6-Br ₃ |
| | 17 | 2-J |
| | 18 | 4-J |
| | 19 | 2,4-J ₂ |
| 25 | 20 | 2-Cl, 4-F |
| | 21 | 2-Cl, 6-F |
| | 22 | 2-Cl, 4-Br |
| | 23 | 2-Cl, 6-Br |
| 30 | 24 | 2-Br, 4-Cl |
| | 25 | 2-Br, 4-F |
| | 26 | 2-Br, 6-F |
| | 27 | 2-F, 4-Cl |
| | 28 | 2,6-Cl ₂ , 4-Br |
| 35 | 29 | 2-CH ₃ |
| | 30 | 3-CH ₃ |
| | 31 | 4-CH ₃ |
| | 32 | 2,3-(CH ₃) ₂ |
| 40 | 33 | 2,4-(CH ₃) ₂ |
| | 34 | 2,5-(CH ₃) ₂ |
| | 35 | 2,6-(CH ₃) ₂ |
| | 36 | 3,4-(CH ₃) ₂ |
| 45 | 37 | 3,5-(CH ₃) ₂ |
| | 38 | 2,3,5-(CH ₃) ₃ |
| | 39 | 2,3,4-(CH ₃) ₃ |

| | Nummer | (R ^x) _p |
|----|--------|---|
| 5 | 40 | 2,3,6-(CH ₃) ₃ |
| | 41 | 2,4,5-(CH ₃) ₃ |
| | 42 | 2,4,6-(CH ₃) ₃ |
| | 43 | 3,4,5-(CH ₃) ₃ |
| | 44 | 2,3,4,6-(CH ₃) ₄ |
| 10 | 45 | 2,3,5,6-(CH ₃) ₄ |
| | 46 | 2,3,4,5,6-(CH ₃) ₅ |
| | 47 | 2-C ₂ H ₅ |
| | 48 | 3-C ₂ H ₅ |
| | 49 | 4-C ₂ H ₅ |
| 15 | 50 | 2,4-(C ₂ H ₅) ₅ |
| | 51 | 2,6-(C ₂ H ₅) ₂ |
| | 52 | 3,5-(C ₂ H ₅) ₂ |
| | 53 | 2,4,6-(C ₂ H ₅) ₃ |
| | 54 | 2-n-C ₃ H ₇ |
| 20 | 55 | 3-n-C ₃ H ₇ |
| | 56 | 4-n-C ₃ H ₇ |
| | 57 | 2-i-C ₃ H ₇ |
| | 58 | 3-i-C ₃ H ₇ |
| | 59 | 4-i-C ₃ H ₇ |
| 25 | 60 | 2,4-(i-C ₃ H ₇) ₂ |
| | 61 | 2,6-(i-C ₃ H ₇) ₂ |
| | 62 | 3,5-(i-C ₃ H ₇) ₂ |
| | 63 | 2-s-C ₄ H ₉ |
| | 64 | 3-s-C ₄ H ₉ |
| 30 | 65 | 4-s-C ₄ H ₉ |
| | 66 | 2-t-C ₄ H ₉ |
| | 67 | 3-t-C ₄ H ₉ |
| | 68 | 4-t-C ₄ H ₉ |
| | 69 | 2-CH ₃ , 4-t-C ₄ H ₉ |
| 35 | 70 | 2-CH ₃ , 6-t-C ₄ H ₉ |
| | 71 | 2-CH ₃ , 4-i-C ₃ H ₇ |
| | 72 | 2-CH ₃ , 5-i-C ₃ H ₇ |
| | 73 | 3-CH ₃ , 4-i-C ₃ H ₇ |
| | 74 | 2-Cl, 4-C ₆ H ₅ |
| 40 | 75 | 2-Br, 4-C ₆ H ₅ |
| | 76 | 2-OCH ₃ |
| | 77 | 3-OCH ₃ |
| | 78 | 4-OCH ₃ |
| | | |

| | Nummer | (R ^x) _p |
|----|--------|--|
| | 79 | 2-OC ₂ H ₅ |
| | 80 | 3-O-C ₂ H ₅ |
| 5 | 81 | 4-O-C ₂ H ₅ |
| | 82 | 2-O-n-C ₃ H ₇ |
| | 83 | 3-O-n-C ₃ H ₇ |
| | 84 | 4-O-n-C ₃ H ₇ |
| 10 | 85 | 2-O-i-C ₃ H ₇ |
| | 86 | 3-O-i-C ₃ H ₇ |
| | 87 | 4-O-i-C ₃ H ₇ |
| | 88 | 2-O-n-C ₆ H ₁₃ |
| | 89 | 3-O-n-C ₆ H ₁₃ |
| 15 | 90 | 4-O-n-C ₆ H ₁₃ |
| | 91 | 2-O-CH ₂ C ₆ H ₅ |
| | 92 | 3-O-CH ₂ C ₆ H ₅ |
| | 93 | 4-O-CH ₂ C ₆ H ₅ |
| 20 | 94 | 2,3-(OCH ₃) ₂ |
| | 95 | 2,4-(OCH ₃) ₂ |
| | 96 | 2,5-(OCH ₃) ₂ |
| | 97 | 2,6-(OCH ₃) ₂ |
| 25 | 98 | 3,4-(OCH ₃) ₂ |
| | 99 | 3,5-(OCH ₃) ₂ |
| | 100 | 2-O-t-C ₄ H ₉ |
| | 101 | 3-O-t-C ₄ H ₉ |
| | 102 | 4-O-t-C ₄ H ₉ |
| 30 | 103 | 2-O-C ₆ H ₅ |
| | 104 | 3-O-C ₆ H ₅ |
| | 105 | 4-O-C ₆ H ₅ |
| | 106 | 2-O-(2'-F-C ₆ H ₄) |
| 35 | 107 | 3-O-(3'-Cl-C ₆ H ₄) |
| | 108 | 4-O-(4'-CH ₃ -C ₆ H ₄) |
| | 109 | 2,3,6-(CH ₃) ₃ , 4-F |
| | 110 | 2,3,6-(CH ₃) ₃ , 4-Cl |
| 40 | 111 | 2,3,6-(CH ₃) ₃ , 4-Br |
| | 112 | 2-i-C ₃ H ₇ , 4-Cl, 5-CH ₃ |
| | 113 | 2-CH ₃ , 5-i-C ₃ H ₇ , 4-Cl |
| | 114 | 2-CH ₂ -OCH ₃ |
| 45 | 115 | 3-CH ₂ -OCH ₃ |
| | 116 | 4-CH ₂ -OCH ₃ |
| | 117 | 2-C ₆ H ₅ |

| | Nummer | (R ^x) _p |
|----|--------|--|
| | 118 | 3-C ₆ H ₅ |
| | 119 | 4-C ₆ H ₅ |
| 5 | 120 | 2-(2'-F-C ₆ H ₄) |
| | 121 | 2-(3'-F-C ₆ H ₄) |
| | 122 | 2-(4'-F-C ₆ H ₄) |
| | 123 | 3-(2'-F-C ₆ H ₄) |
| 10 | 124 | 3-(3'-F-C ₆ H ₄) |
| | 125 | 3-(4'-F-C ₆ H ₄) |
| | 126 | 4-(2'-F-C ₆ H ₄) |
| | 127 | 4-(3'-F-C ₆ H ₄) |
| | 128 | 4-(4'-F-C ₆ H ₄) |
| 15 | 129 | 3-(3'-Cl-C ₆ H ₄) |
| | 130 | 4-(4'-CH ₃ -C ₆ H ₄) |
| | 131 | 2-CF ₃ |
| | 132 | 3-CF ₃ |
| 20 | 133 | 4-CF ₃ |
| | 134 | 2-OCF ₃ |
| | 135 | 3-OCF ₃ |
| | 136 | 4-OCF ₃ |
| 25 | 137 | 3-OCH ₂ CHF ₂ |
| | 138 | 2-CN |
| | 139 | 3-CN |
| | 140 | 4-CN |
| 30 | 141 | 2-F, 3-CH ₃ |
| | 142 | 2-F, 4-CH ₃ |
| | 143 | 2-F, 5-CH ₃ |
| | 144 | 2-F, 6-CH ₃ |
| | 145 | 2-Cl, 3-CH ₃ |
| 35 | 146 | 2-Cl, 4-CH ₃ |
| | 147 | 2-Cl, 5-CH ₃ |
| | 148 | 2-Cl, 6-CH ₃ |
| | 149 | 2-Br, 3-CH ₃ |
| 40 | 150 | 2-Br, 4-CH ₃ |
| | 151 | 2-Br, 5-CH ₃ |
| | 152 | 2-Br, 6-CH ₃ |
| | 153 | 4-F, 2-CH ₃ |
| 45 | 154 | 4-F, 3-CH ₃ |
| | 155 | 4-Cl, 2-CH ₃ |
| | 156 | 4-Cl, 3-CH ₃ |

| | Nummer | (R ^x) _p |
|----|--------|---|
| | 157 | 4-Br, 2-CH ₃ |
| | 158 | 4-Br, 3-CH ₃ |
| 5 | 159 | 2-F, 3,5-(CH ₃) ₂ |
| | 160 | 2-F, 3,4-(CH ₃) ₂ |
| | 161 | 2-F, 3,6-(CH ₃) ₂ |
| | 162 | 2-F, 4,5-(CH ₃) ₂ |
| 10 | 163 | 2-F, 4,6-(CH ₃) ₂ |
| | 164 | 2-F, 5,6-(CH ₃) ₂ |
| | 165 | 2-Cl, 3,5-(CH ₃) ₂ |
| | 166 | 2-Cl, 3,4-(CH ₃) ₂ |
| | 167 | 2-Cl, 3,6-(CH ₃) ₂ |
| 15 | 168 | 2-Cl, 4,5-(CH ₃) ₂ |
| | 169 | 2-Cl, 4,6-(CH ₃) ₂ |
| | 170 | 2-Cl, 5,6-(CH ₃) ₂ |
| | 171 | 2-Br, 3,5-(CH ₃) ₂ |
| 20 | 172 | 2-Br, 3,4-(CH ₃) ₂ |
| | 173 | 2-Br, 3,6-(CH ₃) ₂ |
| | 174 | 2-Br, 4,5-(CH ₃) ₂ |
| | 175 | 2-Br, 4,6-(CH ₃) ₂ |
| 25 | 176 | 2-Br, 5,6-(CH ₃) ₂ |
| | 177 | 4-F, 2,3-(CH ₃) ₂ |
| | 178 | 4-F, 2,5-(CH ₃) ₂ |
| | 179 | 4-F, 2,6-(CH ₃) ₂ |
| 30 | 180 | 4-F, 3,5-(CH ₃) ₂ |
| | 181 | 4-F, 3,6-(CH ₃) ₂ |
| | 182 | 4-Cl, 2,3-(CH ₃) ₂ |
| | 183 | 4-Cl, 2,5-(CH ₃) ₂ |
| | 184 | 4-Cl, 2,6-(CH ₃) ₂ |
| 35 | 185 | 4-Cl, 3,5-(CH ₃) ₂ |
| | 186 | 4-Cl, 3,6-(CH ₃) ₂ |
| | 187 | 4-Br, 2,3-(CH ₃) ₂ |
| | 188 | 4-Br, 2,5-(CH ₃) ₂ |
| 40 | 189 | 4-Br, 2,6-(CH ₃) ₂ |
| | 190 | 4-Br, 3,5-(CH ₃) ₂ |
| | 191 | 4-Br, 3,6-(CH ₃) ₂ |
| | 192 | 2,4-F ₂ , 3-CH ₃ |
| 45 | 193 | 2,4-F ₂ , 5-CH ₃ |
| | 194 | 2,4-F ₂ , 6-CH ₃ |
| | 195 | 2,6-F ₂ , 3-CH ₃ |

| | Nummer | (R ^x) _p |
|----|--------|--|
| | 196 | 2,6-F ₂ , 4-CH ₃ |
| | 197 | 2,4-Cl ₂ , 3-CH ₃ |
| 5 | 198 | 2,4-Cl ₂ , 5-CH ₃ |
| | 199 | 2,4-Cl ₂ , 6-CH ₃ |
| | 200 | 2,6-Cl ₂ , 3-CH ₃ |
| | 201 | 2,6-Cl ₂ , 4-CH ₃ |
| 10 | 202 | 2,4-Br ₂ , 3-CH ₃ |
| | 203 | 2,4-Br ₂ , 5-CH ₃ |
| | 204 | 2,4-Br ₂ , 6-CH ₃ |
| | 205 | 2,6-Br ₂ , 3-CH ₃ |
| | 206 | 2,6-Br ₂ , 4-CH ₃ |
| 15 | 207 | 2-SCH ₃ |
| | 208 | 3-SCH ₃ |
| | 209 | 4-SCH ₃ |
| | 210 | 2-SOCH ₃ |
| 20 | 211 | 3-SOCH ₃ |
| | 212 | 4-SOCH ₃ |
| | 213 | 2-SO ₂ CH ₃ |
| | 214 | 3-SO ₂ CH ₃ |
| 25 | 215 | 4-SO ₂ CH ₃ |
| | 216 | 2-CO ₂ CH ₃ |
| | 217 | 3-CO ₂ CH ₃ |
| | 218 | 4-CO ₂ CH ₃ |
| | 219 | 2-CO ₂ C ₂ H ₅ |
| 30 | 220 | 3-CO ₂ C ₂ H ₅ |
| | 221 | 4-CO ₂ C ₂ H ₅ |
| | 222 | 2-CO ₂ -n-C ₃ H ₇ |
| | 223 | 3-CO ₂ -n-C ₃ H ₇ |
| 35 | 224 | 4-CO ₂ -n-C ₃ H ₇ |
| | 225 | 2-CO ₂ -i-C ₃ H ₇ |
| | 226 | 3-CO ₂ -i-C ₃ H ₇ |
| | 227 | 4-CO ₂ -i-C ₃ H ₇ |
| 40 | 228 | 2-CO ₂ -t-C ₄ H ₉ |
| | 229 | 3-CO ₂ -t-C ₄ H ₉ |
| | 230 | 4-CO ₂ -t-C ₄ H ₉ |
| | 231 | 2-COCH ₃ |
| 45 | 232 | 3-COCH ₃ |
| | 233 | 4-COCH ₃ |
| | 234 | 2-COC ₂ H ₅ |

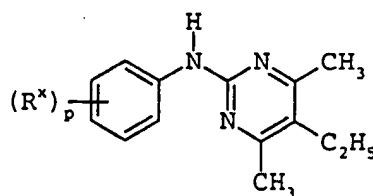
| | Nummer | (R*) _p |
|----|--------|--|
| | 235 | 3-COC ₂ H ₅ |
| | 236 | 4-COC ₂ H ₅ |
| 5 | 237 | 2-CO-n-C ₃ H ₇ |
| | 238 | 3-CO-n-C ₃ H ₇ |
| | 239 | 4-CO-n-C ₃ H ₇ |
| | 240 | 2-CO-i-C ₃ H ₇ |
| 10 | 241 | 3-CO-i-C ₃ H ₇ |
| | 242 | 4-CO-i-C ₃ H ₇ |
| | 243 | 2-CH ₃ , 4-COCH ₃ |
| | 244 | 2,5-(CH ₃) ₂ , 4-COCH ₃ |
| | 245 | 2-Cl, 4-COCH ₃ |
| 15 | 246 | 2-C(=NOCH ₃)-CH ₃ |
| | 247 | 3-C(=NOCH ₃)-CH ₃ |
| | 248 | 4-C(=NOCH ₃)-CH ₃ |
| | 249 | 2-C(=NOC ₂ H ₅)-CH ₃ |
| 20 | 250 | 3-C(=NOC ₂ H ₅)-CH ₃ |
| | 251 | 4-C(=NOC ₂ H ₅)-CH ₃ |
| | 252 | 2-C(=NO-n-C ₃ H ₇)-CH ₃ |
| | 253 | 3-C(=NO-n-C ₃ H ₇)-CH ₃ |
| 25 | 254 | 4-C(=NO-n-C ₃ H ₇)-CH ₃ |
| | 255 | 2-C(=NO-i-C ₃ H ₇)-CH ₃ |
| | 256 | 3-C(=NO-i-C ₃ H ₇)-CH ₃ |
| | 257 | 4-C(=NO-i-C ₃ H ₇)-CH ₃ |
| 30 | 258 | 2-C(=NO-Allyl)-CH ₃ |
| | 259 | 3-C(=NO-Allyl)-CH ₃ |
| | 260 | 4-C(=NO-Allyl)-CH ₃ |
| | 261 | 2-C(=NO-trans-Cl-Allyl)-CH ₃ |
| | 262 | 3-C(=NO-trans-Cl-Allyl)-CH ₃ |
| 35 | 263 | 4-C(=NO-trans-Cl-Allyl)-CH ₃ |
| | 264 | 2-C(=NO-Propargyl)-CH ₃ |
| | 265 | 3-C(=NO-Propargyl)-CH ₃ |
| | 266 | 4-C(=NO-Propargyl)-CH ₃ |
| 40 | 267 | 2,5-(CH ₃) ₂ , 4-C(=NOCH ₃)-CH ₃ |
| | 268 | 2-Cl, 5-CH ₃ , 4-C(=NOCH ₃)-CH ₃ |
| | 269 | 2-CO-NH ₂ |
| | 270 | 3-CO-NH ₂ |
| 45 | 271 | 4-CO-NH ₂ |
| | 272 | 2-CO-NHCH ₃ |
| | 273 | 3-CO-NHCH ₃ |

| | Nummer | (R ^x) _p |
|----|--------|---|
| | 274 | 4-CO-NHCH ₃ |
| | 275 | 2-CO-NHC ₂ H ₅ |
| 5 | 276 | 3-CO-NHC ₂ H ₅ |
| | 277 | 4-CO-NHC ₂ H ₅ |
| | 278 | 2-CO-NH-t-C ₄ H ₉ |
| | 279 | 3-CO-NH-t-C ₄ H ₉ |
| 10 | 280 | 4-CO-NH-t-C ₄ H ₉ |
| | 281 | 2-CO-NH-Allyl |
| | 282 | 3-CO-NH-Allyl |
| | 283 | 4-CO-NH-Allyl |
| | 284 | 2-CO-NH-Propargyl |
| 15 | 285 | 3-CO-NH-Propargyl |
| | 286 | 4-CO-NH-Propargyl |
| | 287 | 2-CO-NH-(CH ₂ C ₆ H ₅) |
| | 288 | 3-CO-NH-(CH ₂ C ₆ H ₅) |
| 20 | 289 | 4-CO-NH-(CH ₂ C ₆ H ₅) |
| | 290 | 2-CO-N(CH ₃) ₂ |
| | 291 | 3-CO-N(CH ₃) ₂ |
| | 292 | 4-CO-N(CH ₃) ₂ |
| 25 | 293 | 2-CO-N(C ₂ H ₅) ₂ |
| | 294 | 3-CO-N(C ₂ H ₅) ₂ |
| | 295 | 4-CO-N(C ₂ H ₅) ₂ |
| | 296 | 2-CO-N(n-C ₃ H ₇) ₂ |
| | 297 | 3-CO-N(n-C ₃ H ₇) ₂ |
| 30 | 298 | 4-CO-N(n-C ₃ H ₇) ₂ |
| | 299 | 2-CO-N(i-C ₃ H ₇) ₂ |
| | 300 | 3-CO-N(i-C ₃ H ₇) ₂ |
| | 301 | 4-CO-N(i-C ₃ H ₇) ₂ |
| 35 | 302 | 2-CO-N(t-C ₄ H ₉) ₂ |
| | 303 | 3-CO-N(t-C ₄ H ₉) ₂ |
| | 304 | 4-CO-N(t-C ₄ H ₉) ₂ |
| | 305 | 2-CO-N(CH ₃)CH ₂ C ₆ H ₅ |
| 40 | 306 | 3-CO-N(CH ₃)CH ₂ C ₆ H ₅ |
| | 307 | 4-CO-N(CH ₃)CH ₂ C ₆ H ₅ |
| | 308 | 2-CO-N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| | 309 | 3-CO-N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| 45 | 310 | 4-CO-N(CH ₃)C ₂ H ₅ |
| | 311 | 2-CO-N(CH ₃)n-C ₃ H ₇ |
| | 312 | 3-CO-N(CH ₃)n-C ₃ H ₇ |

| | Nummer | (R ^x) _p |
|----|--------|--|
| | 313 | 4-CO-N(CH ₃) n-C ₃ H ₇ |
| | 314 | 2-CO-N(CH ₃) i-C ₃ H ₇ |
| 5 | 315 | 3-CO-N(CH ₃) i-C ₃ H ₇ |
| | 316 | 4-CO-N(CH ₃) i-C ₃ H ₇ |
| | 317 | 2-CO-N(CH ₃) t-C ₄ H ₉ |
| | 318 | 3-CO-N(CH ₃) t-C ₄ H ₉ |
| 10 | 319 | 4-CO-N(CH ₃) t-C ₄ H ₉ |
| | 320 | 2-CO-N(CH ₃) Allyl |
| | 321 | 3-CO-N(CH ₃) Allyl |
| | 322 | 4-CO-N(CH ₃) Allyl |
| | 323 | 2-CO-N(CH ₃) Propargyl |
| 15 | 324 | 3-CO-N(CH ₃) Propargyl |
| | 325 | 4-CO-N(CH ₃) Propargyl |
| | 326 | 2-NH-CO-CH ₃ |
| | 327 | 3-NH-CO-CH ₃ |
| 20 | 328 | 4-NH-CO-CH ₃ |
| | 329 | 2-NH-CO-C ₂ H ₅ |
| | 330 | 3-NH-CO-C ₂ H ₅ |
| | 331 | 4-NH-CO-C ₂ H ₅ |
| 25 | 332 | 2-NH-CO-n-C ₃ H ₇ |
| | 333 | 3-NH-CO-n-C ₃ H ₇ |
| | 334 | 4-NH-CO-n-C ₃ H ₇ |
| | 335 | 2-NH-CO-t-C ₄ H ₉ |
| | 336 | 3-NH-CO-t-C ₄ H ₉ |
| 30 | 337 | 4-NH-CO-t-C ₄ H ₉ |
| | 338 | 2-NH-CO-CH=CH-CH ₃ |
| | 339 | 3-NH-CO-CH=CH-CH ₃ |
| | 340 | 4-NH-CO-CH=CH-CH ₃ |
| 35 | 341 | 2-NH-CO-C ₆ H ₅ |
| | 342 | 3-NH-CO-C ₆ H ₅ |
| | 343 | 4-NH-CO-C ₆ H ₅ |
| | 344 | 2-N(CH ₃)-CO-CH ₃ |
| 40 | 345 | 3-N(CH ₃)-CO-CH ₃ |
| | 346 | 4-N(CH ₃)-CO-CH ₃ |
| | 347 | 2-N(CH ₃)-CO-C ₂ H ₅ |
| | 348 | 3-N(CH ₃)-CO-C ₂ H ₅ |
| | 349 | 4-N(CH ₃)-CO-C ₂ H ₅ |
| 45 | 350 | 2-N(CH ₃)-CO-n-C ₃ H ₇ |
| | 351 | 3-N(CH ₃)-CO-n-C ₃ H ₇ |

| Nummer | (R ^x) _p |
|--------|--|
| 352 | 4-N(CH ₃)-CO-n-C ₃ H ₇ |
| 353 | 2-N(CH ₃)-CO-i-C ₃ H ₇ |
| 354 | 3-N(CH ₃)-CO-i-C ₃ H ₇ |
| 355 | 4-N(CH ₃)-CO-i-C ₃ H ₇ |
| 356 | 2-N(CH ₃)-CO-t-C ₄ H ₉ |
| 357 | 3-N(CH ₃)-CO-t-C ₄ H ₉ |
| 358 | 4-N(CH ₃)-CO-t-C ₄ H ₉ |
| 359 | 2-N(CH ₃)-CO-CH=CH-CH ₃ |
| 360 | 3-N(CH ₃)-CO-CH=CH-CH ₃ |
| 361 | 4-N(CH ₃)-CO-CH=CH-CH ₃ |
| 362 | 2-N(CH ₃)-CO-C ₆ H ₅ |
| 363 | 3-N(CH ₃)-CO-C ₆ H ₅ |
| 364 | 4-N(CH ₃)-CO-C ₆ H ₅ |
| 365 | 2-N(C ₂ H ₅)-CO-CH ₃ |
| 366 | 3-N(C ₂ H ₅)-CO-CH ₃ |
| 367 | 4-N(C ₂ H ₅)-CO-CH ₃ |
| 368 | 2-N(n-C ₃ H ₇)-CO-CH ₃ |
| 369 | 3-N(n-C ₃ H ₇)-CO-CH ₃ |
| 370 | 4-N(n-C ₃ H ₇)-CO-CH ₃ |
| 371 | 2-N(i-C ₃ H ₇)-CO-CH ₃ |
| 372 | 3-N(i-C ₃ H ₇)-CO-CH ₃ |
| 373 | 4-N(i-C ₃ H ₇)-CO-CH ₃ |
| 374 | 2-N(t-C ₄ H ₉)-CO-CH ₃ |
| 375 | 3-N(t-C ₄ H ₉)-CO-CH ₃ |
| 376 | 4-N(t-C ₄ H ₉)-CO-CH ₃ |
| 377 | 2-N(CH ₂ C ₆ H ₅)-CO-CH ₃ |
| 378 | 3-N(CH ₂ C ₆ H ₅)-CO-CH ₃ |
| 379 | 4-N(CH ₂ C ₆ H ₅)-CO-CH ₃ |

Tabelle 2

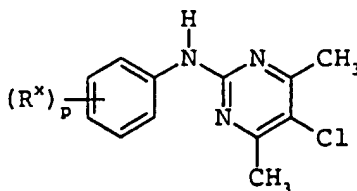


I.2

2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.2-001 bis I.2-379 der allgemeinen Formel I.2, in welcher die Bedeutung von (R^x)_p durch die Zeilen der Tabelle 1 gegeben ist.

Tabelle 3

5

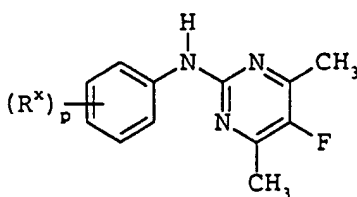


I.3

2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.3-001 bis I.3-379 der allgemeinen Formel I.3, in welcher die Bedeutung von $(R^*)_p$ durch die Zeilen
10 der Tabelle 1 gegeben ist.

Tabelle 4

15

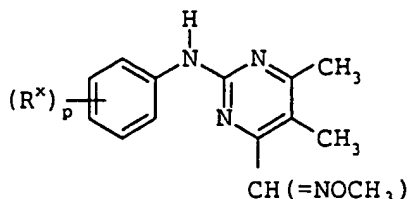


I.4

20 2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.4-001 bis I.4-379 der allgemeinen Formel I.4, in welcher die Bedeutung von $(R^*)_p$ durch die Zeilen der Tabelle 1 gegeben ist.

Tabelle 5

25



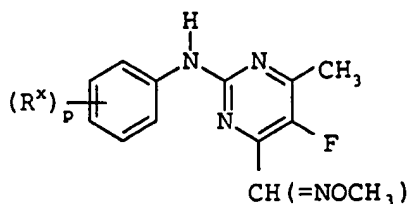
I.5

30

2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.5-001 bis I.5-379 der allgemeinen Formel I.5, in welcher die Bedeutung von $(R^*)_p$ durch die Zeilen der Tabelle 1 gegeben ist.

35 Tabelle 6

40

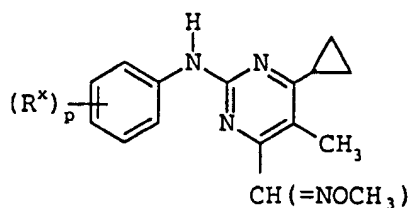


I.6

45 2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.6-001 bis I.6-379 der allgemeinen Formel I.6, in welcher die Bedeutung von $(R^*)_p$ durch die Zeilen der Tabelle 1 gegeben ist.

Tabelle 7

5



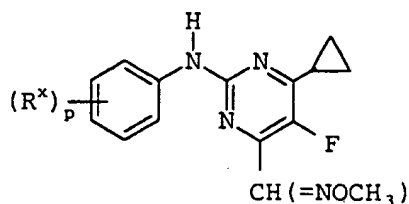
I.7

2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.7-001 bis I.7-379 der allgemeinen Formel I.7, in welcher die Bedeutung von $(\text{R}^*)_{\text{p}}$ durch die Zeilen der Tabelle 1 gegeben ist.

10

Tabelle 8

15



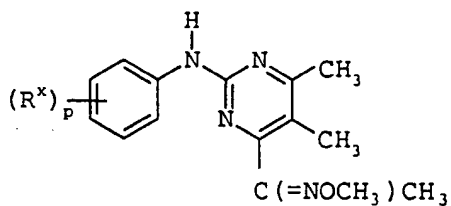
I.8

2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.8-001 bis I.8-379 der allgemeinen Formel I.8, in welcher die Bedeutung von $(\text{R}^*)_{\text{p}}$ durch die Zeilen der Tabelle 1 gegeben ist.

20

Tabelle 9

25



I.9

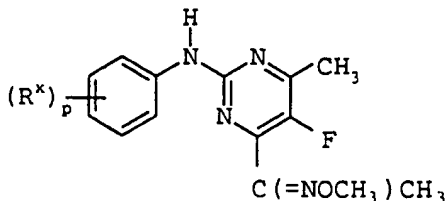
30

2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.9-001 bis I.9-379 der allgemeinen Formel I.9, in welcher die Bedeutung von $(\text{R}^*)_{\text{p}}$ durch die Zeilen der Tabelle 1 gegeben ist.

35

Tabelle 10

40



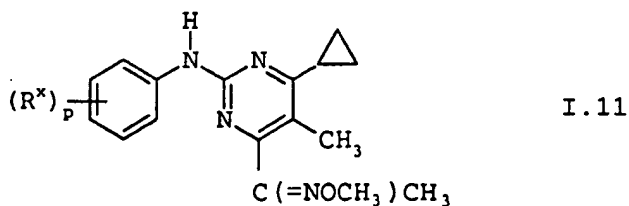
I.10

2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.10-001 bis I.10-379 der allgemeinen Formel I.10, in welcher die Bedeutung von $(\text{R}^*)_{\text{p}}$ durch die Zeilen der Tabelle 1 gegeben ist.

45

Tabelle 11

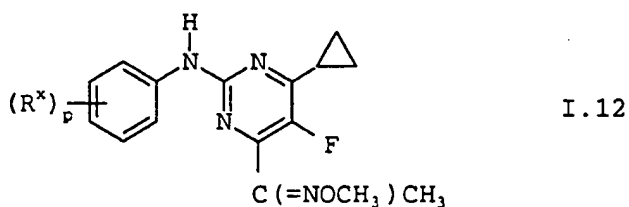
5



2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.11-001 bis I.11-379 der allgemeinen Formel I.11, in welcher die Bedeutung von $(R^*)_p$ durch die Zeilen
10 der Tabelle 1 gegeben ist.

Tabelle 12

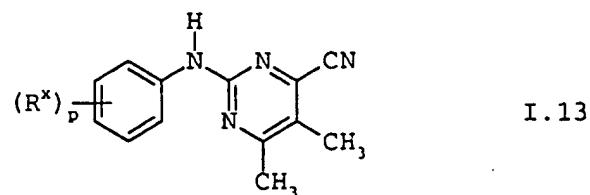
15



2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.12-001 bis I.12-379 der allgemeinen Formel I.12, in welcher die Bedeutung von $(R^*)_p$ durch die Zeilen
20 der Tabelle 1 gegeben ist.

Tabelle 13

25

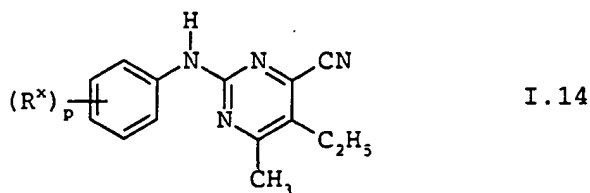


30

2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.13-001 bis I.13-379 der allgemeinen Formel I.13, in welcher die Bedeutung von $(R^*)_p$ durch die Zeilen
der Tabelle 1 gegeben ist.

35 Tabelle 14

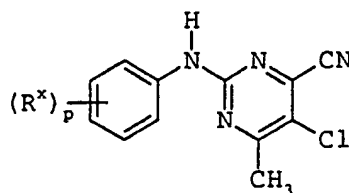
40



2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.14-001 bis I.14-379 der allgemeinen Formel I.14, in welcher die Bedeutung von $(R^*)_p$ durch die Zeilen
45 der Tabelle 1 gegeben ist.

Tabelle 15

5

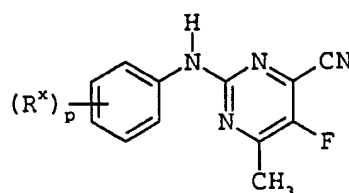


I.15

2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.15-001 bis I.15-379 der allgemeinen Formel I.15, in welcher die Bedeutung von $(R^*)_p$ durch die Zeilen
10 der Tabelle 1 gegeben ist.

Tabelle 16

15

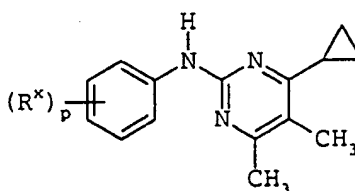


I.16

20 2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.16-001 bis I.16-379 der allgemeinen Formel I.16, in welcher die Bedeutung von $(R^*)_p$ durch die Zeilen der Tabelle 1 gegeben ist.

Tabelle 17

25



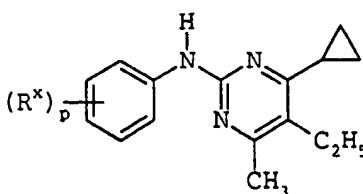
I.17

30

2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.17-001 bis I.17-379 der allgemeinen Formel I.17, in welcher die Bedeutung von $(R^*)_p$ durch die Zeilen der Tabelle 1 gegeben ist.

35 Tabelle 18

40

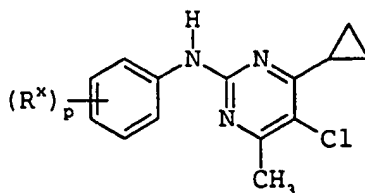


I.18

2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.18-001 bis I.18-379 der allgemeinen Formel I.18, in welcher die Bedeutung von $(R^*)_p$ durch die Zeilen
45 der Tabelle 1 gegeben ist.

Tabelle 19

5

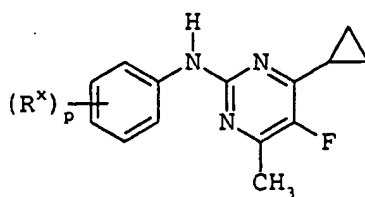


I.19

2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.19-001 bis I.19-379 der allgemeinen Formel I.19, in welcher die Bedeutung von $(R^*)_p$ durch die Zeilen
10 der Tabelle 1 gegeben ist.

Tabelle 20

15

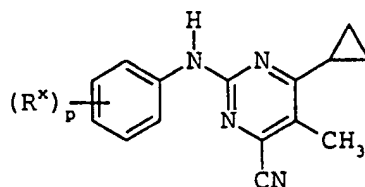


I.20

20 2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.20-001 bis I.20-379 der allgemeinen Formel I.20, in welcher die Bedeutung von $(R^*)_p$ durch die Zeilen der Tabelle 1 gegeben ist.

Tabelle 21

25

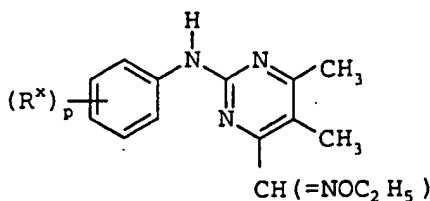


I.21

30 2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.21-001 bis I.21-379 der allgemeinen Formel I.21, in welcher die Bedeutung von $(R^*)_p$ durch die Zeilen der Tabelle 1 gegeben ist.

35 Tabelle 22

40

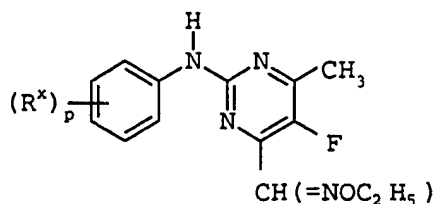


I.22

2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.22-001 bis I.22-379 der allgemeinen Formel I.22, in welcher die Bedeutung von $(R^*)_p$ durch die Zeilen
45 der Tabelle 1 gegeben ist.

Tabelle 23

5

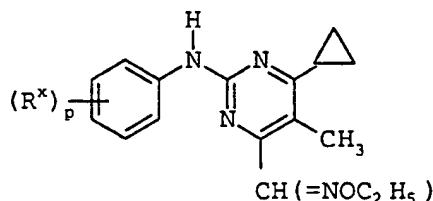


I.23

2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.23-001 bis I.23-379 der allgemeinen Formel I.23, in welcher die Bedeutung von $(R^x)_p$ durch die Zeilen
 10 der Tabelle 1 gegeben ist.

Tabelle 24

15

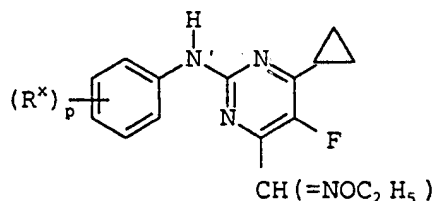


I.24

2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.24-001 bis I.24-379 der allgemeinen Formel I.24, in welcher die Bedeutung von $(R^x)_p$ durch die Zeilen
 20 der Tabelle 1 gegeben ist.

Tabelle 25

25



I.25

30

2-(N-Phenylamino)pyrimidine I.25-001 bis I.25-379 der allgemeinen Formel I.25, in welcher die Bedeutung von $(R^x)_p$ durch die Zeilen
 der Tabelle 1 gegeben ist.

35 Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der *Ascomyceten*, *Deuteromyceten*, *Phycomyceten* und *Basidiomyceten*, aus. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzen-
 40 schutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaf-
 45 fee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen

wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

- *Alternaria*-Arten an Gemüse und Obst,
- *Botrytis cinerea* (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- *Cercospora arachidicola* an Erdnüssen,
- 10 ◦ *Erysiphe cichoracearum* und *Sphaerotheca fuliginea* an Kürbisgewächsen,
- *Erysiphe graminis* (echter Mehltau) an Getreide,
- *Fusarium*- und *Verticillium*-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- *Helminthosporium*-Arten an Getreide,
- 15 ◦ *Mycosphaerella*-Arten an Bananen und Erdnüssen,
- *Phytophthora infestans* an Kartoffeln und Tomaten,
- *Plasmopara viticola* an Reben,
- *Podosphaera leucotricha* an Äpfeln,
- *Pseudocercospora herpotrichoides* an Weizen und Gerste,
- 20 ◦ *Pseudoperonospora*-Arten an Hopfen und Gurken,
- *Puccinia*-Arten an Getreide,
- *Pyricularia oryzae* an Reis,
- *Rhizoctonia*-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- *Septoria nodorum* an Weizen,
- 25 ◦ *Uncinula necator* an Reben,
- *Ustilago*-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
- *Venturia*-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.

Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie *Paecilomyces variotii* im Materialschutz (z.B. Holz, 30 Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder 35 die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

40

Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je 45 nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirkstoff pro ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

- 5 Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Kubikmeter behandelten Materials.

10

- Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine
15 feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder

- 20 Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln, wobei im Falle von Wasser als Verdünnungsmittel auch andere organische Lösungsmittel als Hilfs-
lösungsmittel verwendet werden können. Als Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht: Lösungsmittel wie Aromaten (z.B.
25 Xylol), chlorierte Aromaten (z.B. Chlorbenzole), Paraffine (z.B. Erdölfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol), Ketone (z.B. Cyclohexanon), Amine (z.B. Ethanolamin, Dimethylformamid) und Wasser; Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B.
30 hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nicht-ionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.
- 35 Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate und Fettsäuren sowie deren Alkali- und Erdalkalisalze, Salze von sulfatiertem
40 Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenol-
45 polyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxy-

liertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoetheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen,
5 Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte
10 Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Wasser, in Betracht.

15 Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

20 Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Silicagel, Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit,
25 Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

30 Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

35 Beispiele für Formulierungen sind:

- I. 5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 95 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 5 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
40
- II. 30 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit einer Mischung aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man
45

erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit (Wirkstoffgehalt 23 Gew.-%).

- III. 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in
5 einer Mischung gelöst, die aus 90 Gew.-Teilen Xylol, 6 Gew.-
Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid
an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 2 Gew.-Teilen Calciumsalz
der Dodecylbenzolsulfonsäure und 2 Gew.-Teilen des Anlage-
10 rungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl be-
steht (Wirkstoffgehalt 9 Gew.-%).
- IV. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in
einer Mischung gelöst, die aus 60 Gew.-Teilen Cyclohexanon,
30 Gew.-Teilen Isobutanol, 5 Gew.-Teilen des Anlagerungspro-
15 duktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und
5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid
an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 16 Gew.-%).
- V. 80 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit
20 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin-al-
pha-sulfonsäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer
Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 7 Gew.-Teilen
pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer
Hammermühle vermahlen (Wirkstoffgehalt 80 Gew.-%).
- 25 VI. Man vermischt 90 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Ver-
bindung mit 10 Gew.-Teilen N-Methyl- α -pyrrolidon und erhält
eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen ge-
eignet ist (Wirkstoffgehalt 90 Gew.-%).
- 30 VII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in
einer Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon,
30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungspro-
duktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10
35 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid
an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Ver-
teilen der Lösung in 100 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man
eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs ent-
hält.
- 40 VIII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit
3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin- α -
sulfonsäure, 17 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Lignin-
sulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gew.-Teilen pul-
45 verförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Ham-
mermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in

20000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen
5 oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen rich-
10 ten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten
15 oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitete werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden.
20 Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

25 Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

30 Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

35 Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

40

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungiziden oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen
45 I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fun-

gizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemä-
5 Ben Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

- Schwefel, Dithiocarbamate und deren Derivate, wie Ferridimethyldithiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbisdithiocarbamat, Manganethylenbisdithiocarbamat, Mangan-Zinkethylen-
10 ethyldiamin-bis-dithiocarbamat, Tetramethylthiuramdisulfide, Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N-ethylen-bis-dithiocarbamat), Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat), Zink-(N,N'-propylenbis-dithiocarbamat), N,N'-Polypropylenbis-(thiocarbamoyl)disulfid;
- 15 • Nitroderivate, wie Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-isopropylcarbonat, 5-Nitro-isophthalsäure-di-isopropylester;
- heterocyclische Substanzen, wie 2-Heptadecyl-2-imidazolinacetat, 2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin, O,O-Diethylphthalimidophosphonothioat, 5-Amino-1-[bis-(dimethylamino)-phosphinyl]-3-phenyl-1,2,4-triazol, 2,3-Dicyano-1,4-dithioanthrachinon, 2-Thio-1,3-dithiolo[4,5-b]chinoxalin, 1-(Butylcarbamoyle)-2-benzimidazol-carbaminsäuremethylester, 2-Methoxycarbonylamino-benzimidazol, 2-(Furyl-(2))-benzimidazol, 2-(Thiazolyl-(4))-benzimidazol, N-(1,1,2,2-Tetrachlorethylthio)-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-phthalimid,
- N-Dichlorfluormethylthio-N',N'-dimethyl-N-phenyl-schwefelsäurediamid, 5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol, 2-Rhodanmethy-
30 thylthiobenzthiazol, 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol, 4-(2-Chlorphenylhydrazono)-3-methyl-5-isoxazon, Pyridin-2-thio-1-oxid, 8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid, 2-Methyl-5,6-dihydro-4H-pyran-3-carbonsäure-anilid, 2-Methylfuran-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,4,5-Trimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid, N-Cyclohexyl-N-methoxy-2,5-dimethyl-furan-3-carbonsäureamid, 2-Methyl-benzoesäure-anilid, 2-Iod-benzoesäure-anilid, N-Formyl-N-morpholin-2,2,2-trichlorethylacetal, Piperazin-1,4-diylbis-1-(2,2,2-trichlorethyl)-formamid, 1-(3,4-Dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichlorethan, 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morpholin
40 bzw. dessen Salze, 2,6-Dimethyl-N-cyclododecyl-morpholin bzw. dessen Salze, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-cis-2,6-dimethyl-morpholin, N-[3-(p-tert.-Butylphe-

- nyl)-2-methylpropyl]-piperidin, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-ethyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-n-propyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol, N-(n-Propyl)-N-(2,4,6-trichlorphenoxyethyl)-N'-imidazol-yl-harnstoff, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanon, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanol, (2RS,3RS)-1-[3-(2-Chlorphenyl)-2-(4-fluorphenyl)-oxiran-2-ylmethyl]-1H-1,2,4-triazol, α -(2-Chlorphenyl)- α -(4-chlorphenyl)-5-pyrimidin-methanol, 5-Butyl-2-dimethylamino-4-hydroxy-6-methyl-pyrimidin, Bis-(p-chlorphenyl)-3-pyridinmethanol, 1,2-Bis-(3-ethoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol, 1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol,
- Strobilurine wie Methyl-E-methoxyimino-[α -(o-tolyloxy)-o-tolyl]acetat, Methyl-E-2-[2-[6-(2-cyanophenoxy)-pyrimidin-4-yl-oxy]-phenyl]-3-methoxyacrylat, Methyl-E-methoxyimino-[α -(2-phenoxyphenyl)]-acetamid, Methyl-E-methoxyimino-[α -(2,5-dimethylphenoxy)-o-tolyl]-acetamid,
 - Anilinopyrimidine wie N-(4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl)-anilin, N-[4-Methyl-6-(1-propinyl)-pyrimidin-2-yl]-anilin, N-[4-Methyl-6-cyclopropyl-pyrimidin-2-yl]-anilin,
 - Phenylpyrrole wie 4-(2,2-Difluor-1,3-benzodioxol-4-yl)-pyrrol-3-carbonitril,
 - Zimtsäureamide wie 3-(4-Chlorphenyl)-3-(3,4-dimethoxyphenyl)-acrylsäuremorpholid,
 - sowie verschiedene Fungizide, wie Dodecylguanidinacetat, 3-[3-(3,5-Dimethyl-2-oxycyclohexyl)-2-hydroxyethyl]-glutarimid, Hexachlorbenzol, DL-Methyl-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-N-furoyl(2)-alaninat, DL-N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-(2'-methoxyacetyl)-alanin-methyl-ester, N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-chloracetyl-D,L-2-aminobutyrolacton, DL-N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(phenylacetyl)-alaninmethylester, 5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxazolidin, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-5-methyl-5-methoxymethyl-1,3-oxazolidin-2,4-dion, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-1-isopropylcarbamoylhydantoin, N-(3,5-Dichlorphenyl)-1,2-dimethylcyclopropan-1,2-dicarbonsäureimid, 2-Cyano-[N-(ethylaminocarbonyl)-2-methoximino]-acetamid, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-pentyl]-1H-1,2,4-triazol, 2,4-Difluor- α -(1H-1,2,4-triazolyl-1-methyl)-benzhydrylalkohol, N-(3-Chlor-2,6-dinitro-4-trifluormethyl-phenyl)-5-trifluormethyl-3-chlor-2-aminopyridin, 1-((bis-(4-Fluorphenyl)-methylsilyl)-methyl)-1H-1,2,4-triazol.

Synthesebeispiele

Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangs-
5 verbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in den anschließenden Tabellen mit physikalischen Angaben aufgeführt.

1. 4,6-Dimethyl-5-ethyl-2-(N-phenylamino)pyrimidin

10

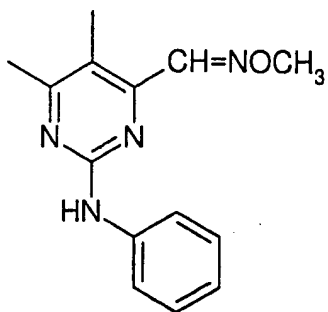
Eine Mischung von 5,5 g (42 mmol) 3-Ethyl-acetylaceton und 6 g (30 mmol) Phenylguanidinium-hydrogencarbonat wurde ca. 3 Stunden auf 100°C erhitzt, wobei ein leichter Unterdruck (200 mbar) angelegt wurde. Anschließend wurde die Reaktionsmi-
15 schung auf Raumtemperatur gekühlt und in Methylenchlorid aufgenommen. Die organische Phase wurde mit Wasser extrahiert, über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeengt. Der Rückstand wurde säulenchromatographisch mit Cyclohexan/Essigester-Gemischen gereinigt. Man erhielt 2,1 g (31%) der Titelverbindung
20 als hellen Festkörper.

¹H-NMR (CDCl₃; δ in ppm): 7,65 (d, 2H); 7,35 (s, breit, 1H); 7,3 (t, 2H); 6,95 (t, 1H); 2,55 (q, 2H); 2,4 (s, 6H); 1,1 (t, 3H).

25 2. 5,6-Dimethyl-4-(N-methoxyimino)methyl-2-(N-phenylamino)pyrimidin

30

35



a) 1,1-Diethoxy-3-methyl-pentan-2,4-dion

Eine Lösung von 43 g (0,22 mol) 1,1-Diethoxy-pentan-2,4-dion in 400 ml Methylenchlorid wurde bei 0°C mit 60 g (0,38 mol) Methyl-iodid und 36 g (0,23 mol) Diazabicyclo-undecen (DBU)
40 versetzt.

Anschließend wurde ca. 3 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Dann gab man zusätzlich 20 g (0,13 mol) DBU hinzu und rührte über Nacht bei Raumtemperatur.
45

Dann wurde die Reaktionsmischung mit Wasser, verdünnter Salzsäure (pH = 1) und Wasser extrahiert, über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeengt. Als Rückstand erhielt man 44 g ei-

nes gelben Öls, das laut GC und ^1H -NMR ca. 50 % der Titelverbindung, 40 % 1,1-Diethoxy-3,3-dimethyl-pentan-2,4-dion sowie ca. 3 % 1,1-Diethoxy-pentan-2,4-dion enthielt.

Das so erhaltene Rohprodukt wurde ohne weitere Reinigung in die nächste Reaktion eingesetzt.

^1H -NMR (CDCl_3 , δ in ppm):

4,65 (s, 1H); 4,05 (q, 1H); 3,7 (m, 4H); 2,25 (s, 3H); 1,2 (m, 9H)

10

b) 5,6-Dimethyl-4-diethoxymethyl-2-(phenylamino)pyrimidin

Eine Mischung von 44 g (Reinheit ca. 50 %ig, ca. 0,11 mol) 1,1-Diethoxy-3-methyl-pentan-2,4-dion (Rohprodukt, Beispiel 2a) und 35 g (0,175 mol) Phenylguanidinium-hydrogencarbonat in 300 ml Ethanol wurde ca. 3 Stunden auf 70-80°C erhitzt. Anschließend wurde die Reaktionsmischung eingeengt und der Rückstand wurde mit Methyl-t-butylether über Kieselgel abgesaugt. Das Lösungsmittel wurde abgedampft. Schwerer flüchtige Bestandteile wurden bei einem Druck von 0,3 mbar und einer Badtemperatur von 150°C abdestilliert. Als Rückstand erhielt man 38 g (Ausbeute quantitativ) der Titelverbindung als gelbes Öl.

25

^1H -NMR (CDCl_3 , δ in ppm):

7,7 (d, 2H); 7,3 (t, 2H); 7,1 (s, breit, 1H); 7,0 (t, 1H); 5,35 (s, 1H); 3,75 (m, 2H); 3,6 (m, 2H); 2,45 (s, 3H); 2,25 (s, 3H); 1,25 (t, 6H)

30 c) 5,6-Dimethyl-4-formyl-2-(phenylamino)pyrimidin

Eine Mischung von 38 g (0,126 mol) 5,6-Dimethyl-4-diethoxymethyl-2-(phenylamino)pyrimidin (Beispiel 2b) und 50 ml konz. Salzsäure in 400 ml Wasser wurde ca. 3 Stunden auf 60°C erhitzt.

35

Anschließend wurde die Reaktionsmischung abgekühlt, wobei ein Festkörper ausfiel. Die Reaktionsmischung wurde mit verdünnter Natronlauge auf pH = 6 gestellt und der ausgefallene Festkörper wurde abgesaugt. Sodann wurde der Festkörper mit Aceton gewaschen und bei einem Druck von ca. 100 mbar und einer Temperatur von 50°C 48 Stunden getrocknet. Man erhielt 29 g (Ausbeute quantitativ) der Titelverbindung als gelben Festkörper.

40

45 ^1H -NMR ($\text{DMSO}-d_6$, δ in ppm):

9,95 (s, 1H); 9,75 (s, breit, 1H); 7,8 (d, 2H); 7,3 (t, 2H);
6,95 (t, 1H); 2,5, (s, 3H); 2,3 (s, 3H)

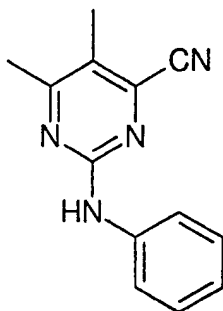
- d) 5,6-Dimethyl-4-(N-methoxyimino)methyl-2-(phenylamino)pyrimidin

Eine Mischung von 1,1 g (5 mmol) 5,6-Dimethyl-4-formyl-2-(phenylamino)pyrimidin (Beispiel 2c) und 0,5 g (6 mmol) O-Methylhydroxylamin-hydrochlorid in 20 ml Methanol wurde ca. 1 Stunde zum Rückfluß erhitzt.

Anschließend wurde die Reaktionsmischung am Rotationsverdampfer eingengt. Der Rückstand wurde in Methylenchlorid aufgenommen und die organische Phase wurde mit NaHCO₃-Lsg. extrahiert. Das Lösungsmittel wurde abgedampft und der Rückstand wurde säulenchromatographisch mit Cyclohexan/Methyl-t-butylether-Gemischen gereinigt. Man erhielt 0,8 g (3,1 mmol, 63 %) der Titelverbindung als gelben Festkörper (Fp = 85-88°C).

¹H-NMR (CDCl₃, δ in ppm):
8,2 (s, 1H); 7,65 (d, 2H); 7,3 (t, 2H); 7,1 (s, breit, 1H);
7,0 (t, 1H); 4,05 (s, 3H); 2,5 (s, 3H); 2,3 (s, 3H)

3. 4-Cyano-5,6-Dimethyl-2-(phenylamino)pyrimidin



Eine Mischung von 2,5 g (11 mmol) 5,6-Dimethyl-4-formyl-2-phenylaminopyrimidin (Beispiel 2c) und 1,2 g (17 mmol) Hydroxylamin-hydrochlorid in 10 ml Pyridin wurde ca. 1,5 Stunden auf 50°C erwärmt.

Anschließend tropfte man 3,5 ml (37 mmol) Acetanhydrid hinzu und rührte die Reaktionsmischung ca. 1,5 Stunde bei 90°C. Dann wurde die Reaktionsmischung am Rotationsverdampfer eingengt. Der Rückstand wurde mit Wasser verdünnt und mit verdünnter Natronlauge auf pH 7-8 gestellt. Die wässrige Phase wurde mit Essigester und Methylenchlorid extrahiert.

Anschließend wurden die vereinigten organischen Phasen über Kieselgel abgesaugt, wobei mit Methylenchlorid/Essigester 2:1 nachgewaschen wurde. Dann wurde die organische Phase eingengt. Der Rückstand kristallisierte und wurde mit Diisopropylether ausgerührt.

5

Man erhielt 1,9 g (75 %) der Titelverbindung als hellen Festkörper (Fp = 181-184°C).

^1H -NMR (CDCl_3 , δ in ppm):

10

7,6 (d, 2H); 7,35 (t, 2H); 7,15 (s, breit, 1H); 7,05 (t, 1H); 2,5 (s, 3H); 2,35 (s, 3H)

15

20

25

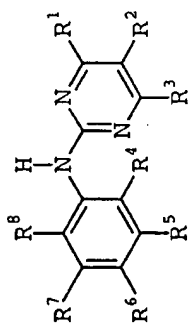
30

35

40

45

Tabelle A (Verbindungen I mit phys. Daten)



| Bsp. | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | Fp (°C), IR (cm ⁻¹) oder ¹ H-NMR (ppm) |
|------|------------------|-------------------------------|-----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|--|
| I.01 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | CH ₃ | H | H | H | H | H | 79-83 |
| I.02 | Cyclo- propyl | C ₂ H ₅ | CH ₃ | H | H | H | H | H | Harz |
| I.03 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | H | H | H | H | 132-135 |
| I.04 | Cyclo- propyl | CH ₃ | CH ₃ | H | H | H | H | H | 76-79 |
| I.05 | CH ₃ | Cl | CH ₃ | H | H | H | H | H | 100-102 |
| I.06 | Cyclo- propyl | Cl | CH ₃ | H | H | H | H | H | 98-100 |
| I.07 | CH ₃ | F | CH ₃ | H | H | H | H | H | 89-93 |
| I.08 | Cyclo- propyl | F | CH ₃ | H | H | H | H | H | 95-97 |
| I.09 | CH ₃ | CH ₃ | CN | H | H | H | H | H | 181-184 |

| Bsp. | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | Fp (°C), IR (cm ⁻¹) oder ¹ H-NMR (ppm) |
|------|---------------------------------|-------------------------------|--------------------------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|--|
| I.10 | CH ₃ | C ₂ H ₅ | CN | H | H | H | H | H | 1597, 1578, 1559, 1527, 1498, 1445, 1427, 1343, 1317, 749 |
| I.11 | i-C ₃ H ₇ | CH ₃ | CN | H | H | H | H | H | 149-153 |
| I.12 | i-C ₃ H ₇ | C ₂ H ₅ | CN | H | H | H | H | H | 3332, 1600, 1573, 1532, 1500, 1487, 1448, 1429, 1532, 761 |
| I.13 | Cyclo- propyl | CH ₃ | CN | H | H | H | H | H | 3339, 1600, 1579, 1561, 1531, 1498, 1447, 1426, 1240, 746 |
| I.14 | Cyclo- propyl | C ₂ H ₅ | CN | H | H | H | H | H | 3323, 1603, 1575, 1533, 1500, 1485, 1446, 1429, 1352, 753 |
| I.15 | C ₂ H ₅ | CH ₃ | CN | H | H | H | H | H | 3357, 1600, 1578, 1563, 1520, 1498, 1462, 1445, 1430, 755 |
| I.16 | Cyclo- propyl | CH ₃ | CH ₃ | Br | H | H | H | H | 118-120 |
| I.17 | Cyclo- propyl | CH ₃ | CH ₃ | H | H | Br | H | H | 96-98 |
| I.18 | CH ₃ | CH ₃ | CF ₃ | H | H | H | H | H | 105-108 |
| I.19 | CH ₃ | CH ₃ | Vinyl | H | H | H | H | H | 110-112 |
| I.20 | CH ₃ | CH ₃ | cis-Prop-enyl-1 | H | H | H | H | H | 86-89 |
| I.21 | CH ₃ | CH ₃ | 2-CH ₃ -Prop-enyl-1 | H | H | H | H | H | 75-101 |
| I.22 | Cyclo- propyl | CH ₃ | Vinyl | H | H | H | H | H | 98-101 |

| Bsp. | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | Fp (°C), IR (cm ⁻¹) oder ¹ H-NMR (ppm) |
|------|----------------|-----------------|--------------------------------|-----------------|-----------------|-----------------|----------------|----------------|--|
| I.23 | Cyclo-propyl | CH ₃ | cis-Prop-enyl-1 | H | H | H | H | H | 79-81 |
| I.24 | Cyclo-propyl | CH ₃ | trans-Prop-enyl-1 | H | H | H | H | H | 76-78 |
| I.25 | Cyclo-propyl | CH ₃ | 2-CH ₃ -Prop-enyl-1 | H | H | H | H | H | 79-84 |
| I.26 | Cyclo-propyl | CH ₃ | CH ₃ | F | H | H | H | H | 1622, 1593, 1568, 1532, 1479, 1448, 1438, 1415, 1252, 749 |
| I.27 | Cyclo-propyl | CH ₃ | CH ₃ | H | F | H | H | H | 80-82 |
| I.28 | Cyclo-propyl | CH ₃ | CH ₃ | H | H | F | H | H | 119-120 |
| I.29 | Cyclo-propyl | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | H | H | H | 95-96 |
| I.30 | Cyclo-propyl | CH ₃ | CH ₃ | H | Cl | H | H | H | 108-110 |
| I.31 | Cyclo-propyl | CH ₃ | CH ₃ | H | H | Cl | H | H | 110-111 |
| I.32 | Cyclo-propyl | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | H | H | H | 126-128 |
| I.33 | Cyclo-propyl | CH ₃ | CH ₃ | H | CH ₃ | H | H | H | 81-83 |
| I.34 | Cyclo-propyl | CH ₃ | CH ₃ | H | H | CH ₃ | H | H | 91-93 |
| I.35 | Cyclo-propyl | CH ₃ | CN | F | H | H | H | H | 172-174 |

| Bsp. | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | Fp (°C), IR (cm ⁻¹) oder ¹ H-NMR (ppm) |
|------|------------------|-----------------|-----------------|-----------------|-----------------|-----------------|----------------|----------------|--|
| I.36 | Cyclo- propyl | CH ₃ | CN | H | F | H | H | H | 188-190 |
| I.37 | Cyclo- propyl | CH ₃ | CN | H | H | F | H | H | 167-169 |
| I.38 | Cyclo- propyl | CH ₃ | CN | Cl | H | H | H | H | 161-162 |
| I.39 | Cyclo- propyl | CH ₃ | CN | H | Cl | H | H | H | 193-194 |
| I.40 | Cyclo- propyl | CH ₃ | CN | H | H | Cl | H | H | 177-179 |
| I.41 | Cyclo- propyl | CH ₃ | CN | CH ₃ | H | H | H | H | 148-150 |
| I.42 | Cyclo- propyl | CH ₃ | CN | H | CH ₃ | H | H | H | 160-161 |
| I.43 | Cyclo- propyl | CH ₃ | CN | H | H | CH ₃ | H | H | 174-176 |
| I.44 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | F | H | H | H | H | 94 |
| I.45 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | F | H | H | H | 167 |
| I.46 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | H | F | H | H | 126 |
| I.47 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | H | H | H | 95 |
| I.48 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | CH ₃ | H | H | H | 169-170 |
| I.49 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | H | CH ₃ | H | H | 171-174 |
| I.50 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | Cl | H | H | H | H | 100-103 |
| I.51 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | Cl | H | H | H | 177 |
| I.52 | CH ₃ | CH ₃ | CH ₃ | H | H | Cl | H | H | 151-154 |
| I.53 | CH ₃ | CH ₃ | CN | F | H | H | H | H | 173-175 |
| I.54 | CH ₃ | CH ₃ | CN | H | F | H | H | H | 185-186 |

| Bsp. | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | Fp (°C), IR (cm ⁻¹) oder ¹ H-NMR (ppm) |
|------|-----------------|-----------------|---|-----------------|-----------------|-----------------|----------------|----------------|--|
| I.55 | CH ₃ | CH ₃ | CN | H | H | F | H | H | 168-170 |
| I.56 | CH ₃ | CH ₃ | CN | CH ₃ | H | H | H | H | 169-170 |
| I.57 | CH ₃ | CH ₃ | CN | H | CH ₃ | H | H | H | 177-179 |
| I.58 | CH ₃ | CH ₃ | CN | H | H | CH ₃ | H | H | 176-179 |
| I.59 | CH ₃ | CH ₃ | CN | Cl | H | H | H | H | 175-176 |
| I.60 | CH ₃ | CH ₃ | CN | H | Cl | H | H | H | 154-156 |
| I.61 | CH ₃ | CH ₃ | CN | H | H | Cl | H | H | 182-184 |
| I.62 | CH ₃ | CH ₃ | CH(=NOCH ₃) | H | H | H | H | H | 85-88 |
| I.63 | CH ₃ | CH ₃ | CH(=NOC ₂ H ₅) | H | H | H | H | H | 78-80 |
| I.64 | CH ₃ | CH ₃ | CH(=NO-i-C ₃ H ₇) | H | H | H | H | H | 64-66 |
| I.65 | CH ₃ | CH ₃ | CH(=NOCH ₂ -C ₆ H ₅) | H | H | H | H | H | 76-79 |
| I.66 | Cyclo-propyl | CH ₃ | CH(=NOCH ₃) | H | H | H | H | H | 93-96 |
| I.67 | Cyclo-propyl | CH ₃ | CH(=NOC ₂ H ₅) | H | H | H | H | H | 90-91 |
| I.68 | Cyclo-propyl | CH ₃ | CH(=NO-i-C ₃ H ₇) | H | H | H | H | H | 100-104 |
| I.69 | Cyclo-propyl | CH ₃ | CH(=NOCH ₂ -C ₆ H ₅) | H | H | H | H | H | 1602, 1594, 1560, 1523, 1497, 1444, 1409, 1012, 751, 696 |
| I.70 | Cyclo-propyl | CH ₃ | CH(=NOH) | H | H | H | H | H | 184-186 |
| I.71 | CH ₃ | CH ₃ | C(CH ₃)=NOCH ₃ unpolares Isomeres | H | H | H | H | H | 2936, 1603, 1564, 1525, 1497, 1444, 1392, 1351, 1259, 1055, 915, 866, 790, 750, 691 |

| Bsp. | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | Fp (°C), IR (cm ⁻¹) oder ¹ H-NMR (ppm) |
|------|------------------|-----------------|--|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|---|
| I.72 | CH ₃ | CH ₃ | C(CH ₃)=NOCH ₃ polares Isomeres | H | H | H | H | H | 148-150 |
| I.73 | CH ₃ | CH ₃ | C(CH ₃)=NOC ₂ H ₅ unpolares Isomeres | H | H | H | H | H | 2977, 2931, 1603, 1564, 1525, 1498, 1444, 1388, 1353, 1258, 1052, 945, 930, 750, 691 |
| I.74 | CH ₃ | CH ₃ | C(CH ₃)=NOC ₂ H ₅ pola- res Isomeres | H | H | H | H | H | 116-118 |
| I.75 | CH ₃ | CH ₃ | C(CH ₃)=NO-i-C ₃ H ₇ unpolares Isomeres | H | H | H | H | H | 2974, 1603, 1564, 1525, 1498, 1444, 1391, 1381, 1369, 1351, 1121, 1000, 956, 750, 691 |
| I.76 | CH ₃ | CH ₃ | C(CH ₃)=NOC ₂ H ₅ -C ₆ H ₅ Isomerengemisch | H | H | H | H | H | 1603, 1595, 1566, 1524, 1497, 1444, 1391, 1364, 1351, 1257, 1055, 1035, 1014, 751, 695 |
| I.77 | Cyclo- propyl | CH ₃ | C(CH ₃)=NOCH ₃ unpolares Isomeres | H | H | H | H | H | 63-65 |
| I.78 | Cyclo- propyl | CH ₃ | C(CH ₃)=NOC ₂ H ₅ unpolares Isomeres | H | H | H | H | H | 55-57 |
| I.79 | Cyclo- propyl | CH ₃ | C(CH ₃)=NO-i-C ₃ H ₇ unpolares Isomeres | H | H | H | H | H | 1606, 1593, 1568, 1527, 1496, 1443, 1425, 1379, 1368, 1358, 1004, 963, 898, 747, 690 |
| I.80 | Cyclo- propyl | CH ₃ | C(CH ₃)=NOC ₂ H ₅ -C ₆ H ₅ unpolares Isomeres | H | H | H | H | H | 1604, 1593, 1559, 1523, 1497, 1444, 1419, 1383, 1354, 1041, 1013, 903, 880, 750, 692 |

| Bsp. | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | R ⁵ | R ⁶ | R ⁷ | R ⁸ | Fp (°C), IR (cm ⁻¹) oder ¹ H-NMR (ppm) |
|------|------------------|-----------------|--|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|--|
| I.81 | Cyclo- propyl | CH ₃ | C(CH ₃)=NOCH ₂ -C ₆ H ₅ polares Isomeres | H | H | H | H | H | 71-73 |
| I.82 | CH ₃ | CH ₃ | C(CH ₃)=NO-i-C ₃ H ₇ polares Isomeres | H | H | H | H | H | 2974, 1603, 1568, 1525, 1498, 1444, 1390, 1381, 1369, 1350, 1121, 1031, 955, 750, 691 |
| I.83 | Cyclo- propyl | CH ₃ | C(CH ₃)=NOCH ₃ polares Isomeres | H | H | H | H | H | 120-122 |
| I.84 | Cyclo- propyl | CH ₃ | C(CH ₃)=NOC ₂ H ₅ polares Isomeres | H | H | H | H | H | 115-117 |
| I.85 | Cyclo- propyl | CH ₃ | C(CH ₃)=NO-i-C ₃ H ₇ polares Isomeres | H | H | H | H | H | 98-102 |

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

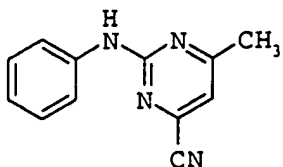
Die fungizide Wirkung der Verbindungen der allgemeinen Formel I
5 ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

Die Wirkstoffe wurden getrennt oder gemeinsam als 10%ige Emulsion
in einem Gemisch aus 70 Gew.-% Cyclohexanon, 20 Gew.-% Nekanil®
LN (Lutensol® AP6, Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung
10 auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) und 10 Gew.-% Wettol®
EM (nichtionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Ri-
cinusöl) aufbereitet und entsprechend der gewünschten Konzentra-
tion mit Wasser verdünnt.

15 Als Vergleichsverbindungen dienten:

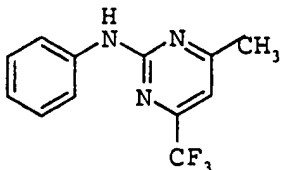
- a) der aus EP-A 457 726 bekannte Wirkstoff A (Tabelle 1,
Nr. 1.1)

20



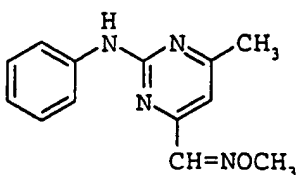
- 25 b) Wirkstoff B (fällt unter die Ansprüche der EP-A 270 111)

30



- c) der aus JP 03-271 278 bekannte Wirkstoff C (Tabelle 1, Nr. 2)

35



40

Vergleichsversuch 1 - Wirksamkeit gegen *Plasmopara viticola*

Blätter von Topfreben der Sorte "Müller-Thurgau" wurden mit 500
ppm wäßriger Wirkstoffaufbereitung, die mit einer Stammlösung aus
45 10 % Wirkstoff, 63 % Cyclohexanon und 27 % Emulgiermittel ange-
setzt wurde, bis zur Tropfnäße besprüht. Um die Dauerwirkung der
Substanzen beurteilen zu können, wurden die Pflanzen nach dem An-

trocknen des Spritzbelages für 7 Tage im Gewächshaus aufgestellt. Erst dann wurden die Blätter mit einer wäßrigen Zoosporenaufschwemmung von *Plasmopara viticola* inokuliert. Danach wurden die Reben zunächst für 48 Stunden in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei 24° C und anschließend für 5 Tage im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 30°C aufgestellt. Nach dieser Zeit wurden die Pflanzen zur Beschleunigung des Sporangienträgerausbruchs abermals für 16 Stunden in eine feuchte Kammer gestellt. Dann wurde das Ausmaß der Befallsentwicklung auf den Blattunterseiten visuell ermittelt.

In diesem Versuch zeigten die mit dem erfindungsgemäßen Wirkstoff I.9 behandelten Pflanzen einen Befall von 5 % während die mit dem bekannten Wirkstoff A behandelten Pflanzen zu 50 % und die unbehandelten Pflanzen zu 85 % befallen waren.

Vergleichsversuch 2 - Kurative Wirksamkeit gegen *Puccinia recondita* an Weizen (Weizenbraunrost)

Blätter von in Töpfen gewachsenen Weizensämlingen der Sorte "Kanzler" wurden mit Sporen des Braunrostes (*Puccinia recondita*) bestäubt. Danach wurden die Töpfe für 24 Stunden in eine Kammer mit hoher Luftfeuchtigkeit (90 bis 95 %) und 20 bis 22° C gestellt. Während dieser Zeit keimten die Sporen aus und die Keimschläuche drangen in das Blattgewebe ein. Die infizierten Pflanzen wurden am nächsten Tag mit 250 ppm einer wäßrigen Wirkstoffaufbereitung, die aus einer Stammlösung bestehend aus 10 % Wirkstoff, 63 % Cyclohexanon und 27 % Emulgiermittel angesetzt worden war, tropfnaß besprüht. Nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Versuchspflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 22° C und 65 bis 70 % relativer Luftfeuchte für 7 Tage kultiviert. Dann wurde das Ausmaß der Rostpilzentwicklung auf den Blättern ermittelt.

In diesem Versuch zeigten die mit dem erfindungsgemäßen Wirkstoff I.9 behandelten Pflanzen einen Befall von 30 % während die mit dem bekannten Wirkstoff A behandelten Pflanzen und die unbehandelten Pflanzen zu 100 % befallen waren.

Vergleichsversuch 3 - Wirksamkeit gegen *Pyricularia oryzae* (protektiv)

Blätter von in Töpfen gewachsenen Reiskeimlingen der Sorte "Tainong 67" wurden mit 250 ppm wäßriger Wirkstoffaufbereitung, die mit einer Stammlösung aus 10 % Wirkstoff, 63 % Cyclohexanon und 27 % Emulgiermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporen-

suspension von *Pyricularia oryzae* inokuliert. Anschließend wurden die Versuchspflanzen in Klimakammern bei 22 - 24° C und 95 - 99 % relativer Luftfeuchtigkeit für 6 Tage aufgestellt. Dann wurde das Ausmaß der Befallsentwicklung auf den Blättern visuell ermittelt.

5

In diesem Versuch zeigten die mit dem erfindungsgemäßen Wirkstoff I.18 behandelten Pflanzen einen Befall von 15 % während die mit dem bekannten Wirkstoff B behandelten Pflanzen zu 80 % und die unbehandelten Pflanzen zu 90 % befallen waren.

10

Vergleichsversuch 4 - Wirksamkeit gegen *Plasmopara viticola*

Blätter von Topfreben der Sorte "Müller-Thurgau" wurden mit 250 ppm wäßriger Wirkstoffaufbereitung, die mit einer Stammlösung aus 15 10 % Wirkstoff, 63 % Cyclohexanon und 27 % Emulgiermittel ange-
setzt wurde, bis zur Tropfnäße besprüht. Um die Dauerwirkung der Substanzen beurteilen zu können, wurden die Pflanzen nach dem Antrocknen des Spritzbelages für 7 Tage im Gewächshaus aufgestellt. Erst dann wurden die Blätter mit einer wäßrigen Zoo- sporenauf-
20 schwemmung von *Plasmopara viticola* inokuliert. Danach wurden die Reben zunächst für 48 Stunden in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei 24° C und anschließend für 5 Tage im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 30°C aufgestellt. Nach dieser Zeit wurden die Pflanzen zur Beschleunigung des Sporangienträgeraus-
25 bruchs abermals für 16 Stunden in eine feuchte Kammer gestellt. Dann wurde das Ausmaß der Befallsentwicklung auf den Blattunterseiten visuell ermittelt.

In diesem Versuch zeigten die mit dem erfindungsgemäßen Wirkstoff 30 I.62 behandelten Pflanzen einen Befall von 10 % während die mit dem bekannten Wirkstoff C behandelten Pflanzen zu 60 % und die unbehandelten Pflanzen zu 85 % befallen waren.

35

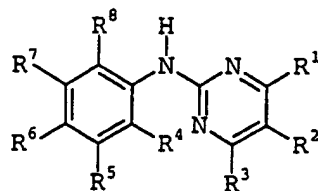
40

45

Patentansprüche

1. Verwendung von 2-(N-Phenylamino)pyrimidinen der Formel I,

5

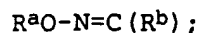


I

10

in der die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

- 15 R^1, R^3 unabhängig voneinander Cyano, C_1 - C_8 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkynyl, wobei die Reste Alkyl, Alkenyl und Alkynyl durch Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy oder C_1 - C_4 -Alkoxycarbonyl substituiert sein können, C_3 - C_8 -Cycloalkyl oder eine Gruppe $C(=NOR^x)R^y$
- 20 R^x Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkynyl, wobei die Reste Alkyl, Alkenyl und Alkynyl durch Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy oder Phenyl substituiert sein können;
- 25 R^y Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkynyl, wobei die Reste Alkyl, Alkenyl und Alkynyl durch Cyano, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiert sein können.
- 30 R^2 Halogen, C_1 - C_8 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkynyl, wobei die Reste Alkyl, Alkenyl und Alkynyl durch Cyano, Halogen, C_1 - C_4 -Alkoxy oder C_1 - C_4 -Alkoxycarbonyl substituiert sein können, oder
- 35 R^1 u. R^2 gemeinsam mit den beiden Kohlenstoffatomen an welche sie gebunden sind einen anellierten, teilweise ungesättigten 4- bis 8-gliedrigen Ring, der bis zu dreifach gleich oder verschieden durch C_1 - C_4 -Alkyl, Halogen oder C_1 - C_4 -Alkoxycarbonyl substituiert sein kann,
- 40 eine Carbonylgruppe und/oder zusätzlich zu der Mehrfachbindung des Pyrimidinrings eine Doppelbindung enthalten kann und/oder durch O, S oder N-(C_1 - C_4 -Alkyl) unterbrochen sein kann;
- 45 R^4 bis R^8 unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, Halogen, R^a , R^aO , $R^aS(O)_m$, $R^aO-(C=O)$, $R^a(C=O)$, $R^aR^bN-(C=O)$, $R^aHN-(C=O)$, $H_2N-(C=O)$, $R^a-(C=O)-NH$, $R^a-(C=O)-NR^b$ oder



- 5 R^a, R^b C_1-C_4 -Alkyl, C_3-C_6 -Alkenyl oder C_3-C_6 -Alkynyl, welche jeweils durch Cyano, Halogen, C_1-C_4 -Alkoxy, C_1-C_4 -Alkoxycarbonyl oder Phenyl substituiert sein können oder Phenyl, welches ein bis drei Substituenten ausgewählt aus der Gruppe: Halogen und C_1-C_4 -Alkyl tragen kann;
- 10 m 0, 1 oder 2;
- als Fungizide.
2. 2-(N-Phenylamino)pyrimidine der Formel I, in der
- 15 R^1, R^3 unabhängig voneinander Cyano, C_1-C_8 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl oder C_3-C_8 -Cycloalkyl oder eine Gruppe $C(=NOR^x)R^y$;
- 20 R^x Wasserstoff oder C_1-C_8 -Alkyl;
- R^y Wasserstoff oder C_1-C_8 -Alkyl;
- 25 R^2 Halogen, C_1-C_8 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkynyl oder C_1-C_2 -Haloalkyl;
- 30 R^4, R^6, R^8 unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, Halogen, R^a , R^aO , $R^aS(O)_m$, $R^aO-(C=O)$, $R^a(C=O)$, $R^aR^bN-(C=O)$, $R^aHN-(C=O)$, $H_2N-(C=O)$, $R^a-(C=O)-NH$, $R^a-(C=O)-NR^b$ oder $R^aO-N=C(R^b)$;
- 35 R^5, R^7 unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, R^a , R^aO , $R^aS(O)_m$, $R^aO-(C=O)$, $R^a(C=O)$, $R^aR^bN-(C=O)$, $R^aHN-(C=O)$, $H_2N-(C=O)$, $R^a-(C=O)-NH$, $R^a-(C=O)-NR^b$ oder $R^aO-N=C(R^b)$;
- 40 R^a, R^b C_1-C_4 -Alkyl, C_3-C_6 -Alkenyl oder C_3-C_6 -Alkynyl, welche jeweils durch Cyano, Halogen, C_1-C_4 -Alkoxy, C_1-C_4 -Alkoxycarbonyl oder Phenyl substituiert sein können oder Phenyl, welches ein bis drei Substituenten ausgewählt aus der Gruppe: Halogen und C_1-C_4 -Alkyl tragen kann, und
- 45 m 0, 1 oder 2 bedeuten.

3. 2-(N-Phenylamino)pyrimidine der Formel I gemäß Anspruch 2, wobei

R^1 Methyl oder Cyclopropyl bedeutet.

5

4. 2-(N-Phenylamino)pyrimidine der Formel I gemäß den Ansprüchen 2 und 3, wobei

R^4 bis R^8 Wasserstoff bedeuten.

10

5. 2-(N-Phenylamino)pyrimidine der Formel I gemäß den Ansprüchen 2-4, wobei

R^2 Halogen oder Methyl bedeutet.

15

6. 2-(N-Phenylamino)pyrimidine der Formel I gemäß den Ansprüchen 2-5, wobei

R^3 $CH(=NOCH_3)$, $CH(=NOC_2H_5)$, $C(=NOCH_3)CH_3$, $C(=NOC_2H_5)CH_3$, Cyano oder Methyl bedeutet.

20

7. 2-(N-Phenylamino)pyrimidine der Formel I, in der

R^1 Methyl oder Cyclopropyl;

25

R^2 Halogen oder Methyl;

R^3 Trifluormethyl;

30

R^4 , R^8 Wasserstoff;

R^5 , R^7 unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, C_1 - C_2 -Haloalkoxy, R^a , R^aO , $R^aS(O)_m$, $R^aO-(C=O)$, $R^a(C=O)$, $R^aR^bN-(C=O)$, $R^aHN-(C=O)$, $H_2N-(C=O)$, $R^a-(C=O)-NH$, $R^a-(C=O)-NR^b$ oder $R^aO-N=C(R^b)$;

35

R^6 unabhängig voneinander Wasserstoff, Cyano, Halogen, C_1 - C_2 -Haloalkyl, C_1 - C_2 -Haloalkoxy, R^a , R^aO , $R^aS(O)_m$, $R^aO-(C=O)$, $R^a(C=O)$, $R^aR^bN-(C=O)$, $R^aHN-(C=O)$, $H_2N-(C=O)$, $R^a-(C=O)-NH$, $R^a-(C=O)-NR^b$ oder $R^aO-N=C(R^b)$;

40

R^a , R^b C_1 - C_4 -Alkyl, C_3 - C_6 -Alkenyl oder C_3 - C_6 -Alkynyl, welche jeweils durch Cyano, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy-carbonyl oder Phenyl substituiert sein können oder

45

Phenyl, welches ein bis drei Substituenten ausgewählt aus der Gruppe: Halogen und C₁-C₄-Alkyl tragen kann,

bedeuten.

5

10

15

20

25

30

35

40

45

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 6 A01N43/54

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 6 A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|------------|---|-----------------------|
| A | EP 0 457 726 A (CIBA GEIGY AG) 21 November 1991 (1991-11-21) cited in the application page 3, line 1-25; example 1.3 --- | 1-7 |
| A | EP 0 270 111 A (KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO ;IHARA CHEMICAL IND CO (JP)) 8 June 1988 (1988-06-08) cited in the application Test Examples 1 and 2. page 4, line 1-21 --- -/-- | 1-7 |

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents :

A document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

E earlier document but published on or after the international filing date

L document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

O document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

P document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

T later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

X document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

Y document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

& document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

29 September 1999

Date of mailing of the international search report

08/10/1999

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Klaver, J

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 99/03751

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages | Relevant to claim No. |
|----------|---|-----------------------|
| A | PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 016, no. 081 (C-0915), 27 February 1992 (1992-02-27) & JP 03 271278 A (NISSAN CHEM IND LTD), 3 December 1991 (1991-12-03) cited in the application abstract --- | 1-7 |
| A | EP 0 172 786 A (CIBA GEIGY AG) 26 February 1986 (1986-02-26) cited in the application Page 1, Paragraph 4 - Page 2, Paragraph 1; Page 9, Paragraph 3. --- | 1-7 |
| A | EP 0 337 944 A (CIBA GEIGY AG) 18 October 1989 (1989-10-18) cited in the application Page 2, Line 8 - 41; Page 10, Line 12 - 50; Table 2. ----- | 1-7 |

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

information on patent family members

International Application No

PCT/EP 99/03751

| Patent document cited in search report | Publication date | Patent family member(s) | Publication date |
|---|---------------------|----------------------------|---------------------|
| EP 0457726 A | 21-11-1991 | AT 133943 T | 15-02-1996 |
| | | AU 644159 B | 02-12-1993 |
| | | AU 7606791 A | 21-11-1991 |
| | | CA 2042670 A | 18-11-1991 |
| | | DE 59107372 D | 21-03-1996 |
| | | DK 457726 T | 11-03-1996 |
| | | ES 2083555 T | 16-04-1996 |
| | | GR 3018935 T | 31-05-1996 |
| | | IE 71916 B | 12-03-1997 |
| | | JP 4226963 A | 17-08-1992 |
| | | US 5439912 A | 08-08-1995 |
| | | | |
| EP 0270111 A | 08-06-1988 | JP 2065338 C | 24-06-1996 |
| | | JP 7084445 B | 13-09-1995 |
| | | JP 63141971 A | 14-06-1988 |
| | | US 4992438 A | 12-02-1991 |
| JP 03271278 A | 03-12-1991 | NONE | |
| | | | |
| EP 0172786 A | 26-02-1986 | AT 60591 T | 15-02-1991 |
| | | AU 585867 B | 29-06-1989 |
| | | AU 4398885 A | 02-01-1986 |
| | | BR 8503024 A | 11-03-1986 |
| | | DK 285285 A | 26-12-1985 |
| | | GR 851534 A | 25-11-1985 |
| | | JP 61015877 A | 23-01-1986 |
| | | PH 22765 A | 12-12-1988 |
| | | PT 80683 A,B | 01-07-1985 |
| | | US 4694009 A | 15-09-1987 |
| EP 0337944 A | 18-10-1989 | AT 92050 T | 15-08-1993 |
| | | ES 2058588 T | 01-11-1994 |
| | | JP 2006477 A | 10-01-1990 |
| | | US 4973690 A | 27-11-1990 |

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 6 A01N43/54

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 6 A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile | Betr. Anspruch Nr. |
|------------|---|--------------------|
| A | EP 0 457 726 A (CIBA GEIGY AG) 21. November 1991 (1991-11-21) in der Anmeldung erwähnt Seite 3, Zeile 1-25; Beispiel 1.3 --- | 1-7 |
| A | EP 0 270 111 A (KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO ; IHARA CHEMICAL IND CO (JP)) 8. Juni 1988 (1988-06-08) in der Anmeldung erwähnt Test Beispiele 1 und 2. Seite 4, Zeile 1-21 --- -/- | 1-7 |

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

Z Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

29. September 1999

Absenddatum des internationalen Recherchenberichts

08/10/1999

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Klaver, J

| C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN | | |
|--|--|--------------------|
| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile | Betr. Anspruch Nr. |
| A | PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 016, no. 081 (C-0915), 27. Februar 1992 (1992-02-27) & JP 03 271278 A (NISSAN CHEM IND LTD), 3. Dezember 1991 (1991-12-03) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung ---- | 1-7 |
| A | EP 0 172 786 A (CIBA GEIGY AG) 26. Februar 1986 (1986-02-26) in der Anmeldung erwähnt Seite 1, Absatz 4 - Seite 2, Absatz 1; Seite 9, Absatz 3. ---- | 1-7 |
| A | EP 0 337 944 A (CIBA GEIGY AG) 18. Oktober 1989 (1989-10-18) in der Anmeldung erwähnt Seite 2, Zeile 8 - 41; Seite 10, Zeile 12 - 50; Tabelle 2. ----- | 1-7 |

INTERNATIONAL RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 99/03751

| Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument | Datum der Veröffentlichung | Mitglied(er) der Patentfamilie | Datum der Veröffentlichung |
|--|-------------------------------|-----------------------------------|-------------------------------|
| EP 0457726 A | 21-11-1991 | AT 133943 T | 15-02-1996 |
| | | AU 644159 B | 02-12-1993 |
| | | AU 7606791 A | 21-11-1991 |
| | | CA 2042670 A | 18-11-1991 |
| | | DE 59107372 D | 21-03-1996 |
| | | DK 457726 T | 11-03-1996 |
| | | ES 2083555 T | 16-04-1996 |
| | | GR 3018935 T | 31-05-1996 |
| | | IE 71916 B | 12-03-1997 |
| | | JP 4226963 A | 17-08-1992 |
| | | US 5439912 A | 08-08-1995 |
| EP 0270111 A | 08-06-1988 | JP 2065338 C | 24-06-1996 |
| | | JP 7084445 B | 13-09-1995 |
| | | JP 63141971 A | 14-06-1988 |
| | | US 4992438 A | 12-02-1991 |
| JP 03271278 A | 03-12-1991 | KEINE | |
| EP 0172786 A | 26-02-1986 | AT 60591 T | 15-02-1991 |
| | | AU 585867 B | 29-06-1989 |
| | | AU 4398885 A | 02-01-1986 |
| | | BR 8503024 A | 11-03-1986 |
| | | DK 285285 A | 26-12-1985 |
| | | GR 851534 A | 25-11-1985 |
| | | JP 61015877 A | 23-01-1986 |
| | | PH 22765 A | 12-12-1988 |
| | | PT 80683 A, B | 01-07-1985 |
| | | US 4694009 A | 15-09-1987 |
| EP 0337944 A | 18-10-1989 | AT 92050 T | 15-08-1993 |
| | | ES 2058588 T | 01-11-1994 |
| | | JP 2006477 A | 10-01-1990 |
| | | US 4973690 A | 27-11-1990 |

THIS PAGE BLANK (USPTO)